# N-SUBSTITUTED INDOLE DERIVATIVE, METHOD FOR PRODUCING THE SAME, AND PEST-CONTROLLING AGENT CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

3

Publication number: JP2003040866

Publication date:

2003-02-13

Inventor:

TANABE TOMOTSUGU; HOTTA HIROKI; TOTANI

TETSUYA; HOSODA KATSUHIKO

Applicant:

NIPPON KAYAKU KK

Classification:
- international:

A01N43/38; A01N43/40; C07D209/12; C07D209/42; C07D401/04; C07D209/12; C07D209/42; A01N43/34; C07D209/00; C07D401/00; C07D209/00; (IPC1-7): C07D209/12; A01N43/38; A01N43/40; C07D209/42;

C07D401/04

- european:

Application number: JP20010230709 20010731 Priority number(s): JP20010230709 20010731

Report a data error here

#### Abstract of JP2003040866

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide a new safe pest-controlling agent effective at a small amount. SOLUTION: This N-substituted indole derivative is represented by general formula (1) (wherein, X is N or CCI; R1 is a 1-6C alkyl group which may be substituted; R2 is H or a 1-6C alkyl group which may be substituted; R3 is H, a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted or a halogen; R5 is a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted or a halogen; R5 is a 1-6C alkyl group which may be substituted, a 1-6C alkoxy group which may be substituted or a halogen; and n is 1 or 2).

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(19)日本国特許庁 (JP)

## (12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号 特開2003-40866 (P2003-40866A)

(43)公開日 平成15年2月13日(2003.2.13)

		(40) 14 5	TM10+27100 (2005.2.10)
l)Int.Cl.'	<b>微別記号</b>	FI	テーマコード(参考)
C 0 7 D 209/12		C 0 7 D 209/12	4 C 0 6 3
A01N 43/38	•	A 0 1 N 43/38	4 C 2 0 4
43/40	101	43/40	101M 4H011
C 0 7 D 209/42		C 0 7 D 209/42	
401/04 ·		401/04	
	•	審查請求 未請求	醋水項の数9 OL (全 19 頁)
)出願番号 特閣	夏2001 — 230709( P2001 — 230709)	(71) 出願人 0000040	086
		日本化	<b>英株式会社</b>
2)出顧日 平成	克13年7月31日(2001.7.31)	東京都	千代田区富士見1丁目11番2号
		(72) 発明者 田辺 🦸	印刷
		埼玉県	<b>督日部市粕壁東3-4-21-204号</b>
		(72)発明者 堀田 †	<b>孝樹</b>
		埼玉県:	さいたま市上落合 6 - 8 - 25 - 204
		(72)発明者 戸谷 🕈	<b>哲也</b>
•		埼玉県	さいたま市上落合 6 - 7 - 8 -201
		(72)発明者 細田 服	<b>赞彦</b>
		埼玉県で	さいたま市蓮沼276-5
			こょうにないが無心

最終頁に続く

## (54)【発明の名称】 N置換インドール誘導体、その製造法及びそれを有効成分とする害虫防除剤

(57) 【要約】

【課題】低薬量で有効かつ安全な新規防除剤の提供。 【解決手段】一般式 (1) 【化1】



式中、例えば、XがNまたはCCIを示し;R.は置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基を示し;R.はHまたは置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基を示し;R.はHまたは間機されていてもよいCi~Ciのアルキル基、置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基、ハロゲン、NO・またはCNを示し;R.は置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基またはハロゲンを示し;R.は置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基またはハロゲンを示し;R.は置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基またはハロゲンを示し;nはIまたは2で示され

る、N置換インドール誘導体を開示する。

【特許請求の範囲】 【請求項1】一般式(1) 【化1】

1

[式中XはNまたはCR。を示し; R. は置換されていてもよ いCi~Ciのアルキル基、置換されていてもよいCi~Ciの アルケニル基、置換されていてもよい(:~ このアルキニ ル基、置換されていてもよいフェニル基、置換されてい てもよいCi~Ciのアルキルチオ基またはNRiRiを示し;R : はH、ハロゲンまたは置換されていてもよいCi ~Ci のア ルキル基を示し; R. はH、置換されていてもよいCi~Ca のアルキル基、置換されていてもよい (?~ ( のアルケニ ル基、置換されていてもよい(!~ にのアルキニル基、置 換されていてもよいい~C、のアルコキシ基、置換されて いてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NRi Ri、ハロゲ >. NO: CN. COR. CO: R. CONR. R. SO: R. SO: NR Re. SORe. SORe. OCORe. OCORe. OCONRe Re. OSO ·R·、置換されていてもよいフェニル基、置換されてい てもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロア リール基または置換されていてもよいヘテロアリールオ キシ基を示し; R. はH、置換されていてもよいC. ~C. の アルキル基、置換されていてもよい()~()のアルコキシ 基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NR rRa、ハロゲン、NO:、CN、CORa、CO: Ra、CONRa Ra、SO: R » . SO: NR; Rs . SOR» . SO: R9 . OCOR» . OCO: R9 . OCONR ; Re、OSO: Re、置換されていてもよいフェニル基、置換 されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよい ヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロア リールオキシ基を示し; R. はH、置換されていてもよいC 1~Gのアルキル基、置換されていてもよいG~Gのア ルコキシ基、NR, R,、ハロゲン、NO: またはCNを示し; R. はHまたはハロゲンを示し: Rr、Rn およびRn はそれぞれ 独立にH、置換されていてもよいCI~CIのアルキル基ま たは置換されていてもよいフェニル基を示すが、Riおよ びR. で5~6員環を形成してもよく;nは1、2、3または4 を示す。〕で表されるN置換インドール誘導体。

【請求項2】XがN、CF、CCIまたはCBrを示し;Ri は置 換されていてもよいい ~ いのアルキル基、置換されてい てもよいフェニル基、 置換されていてもよい (1~ 2. のア ルキルチオ基またはNR: R: を示し; R: はHまたは置換され ていてもよいCi~Ciのアルキル基を示し:RiはH、 置換 されていてもよいい~いのアルキル基、置換されていて もよいC:~C。のアルコキシ基、ハロゲン、NO:またはCN を示し; R. は置換されていてもよいC. ~C. のアルキル 基、置換されていてもよいい~いのアルコキシ基、置換 50

されていてもよいアルキルチオ基、NR: R: またはハロゲ ンを示し; R: は置換されていてもよいG~Gのアルキル 基、置換されていてもよい()~()のアルコキン基、ハロ ゲン、NO: またはCNを示し; Rī、Ri およびRi はそれぞれ 独立にH、置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基ま たは置換されていてもよいフェニル基を示すが、Ri およ びR<sub>1</sub>で5~7員環を形成してもよく; nは1、2 または 3である請求項1に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項3】 XがNまたはCCIを示し; Ri は置換されてい てもよいCi~Ciのアルキル基を示し;RiはHまたは置換 されていてもよいG~Gのアルキル基を示し:Riは H. 置換されていてもよいCi ~Ci のアルキル基、置換されて いてもよいCi~Ciのアルコキシ基、ハロゲン、NO:また はCNを示し; Ri は置換されていてもよいCi~Ciのアルキ ル基、置換されていてもよい()、~(,のアルコキシ基また はハロゲンを示し; Rs は置換されていてもよいCi ~ Ci の アルキル基、置換されていてもよい ( ~ ( のアルコキシ 基またはハロゲンを示し;nは1または2である請求項1 に記載のN置換インドール誘導体。

【請求項4】XがNまたはCCIを示し;Riはハロゲンで置 換されていてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>2</sub>のアルキル基を示し; R<sub>2</sub>はH またはCi~Ciのアルキル基を示し; Riは Hi、ハロゲンで 置換されていてもよい()~(のアルキル基、ハロゲンで 置換されていてもよいい~6. のアルコキシ基またはハロ ゲンを示し; R. はハロゲンで置換されていてもよいC.~ Gのアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよいG~ Gのアルコキシ基またはハロゲンを示し; Ri はハロゲン で置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、ハロゲン で置換されていてもよいい~0.のアルコキシ基またはハ 30 ロゲンを示し; nはlまたは2である請求項1に記載のN 置換インドール誘導体。

【t計求項5】XがNまたはCCIを示し; Ri はトリフルオロ メチル基を示し; R. はHまたはメチル基を示し; R. は II、メチル基、トリフルオロメチル基またはハロゲンを 示し; R. はハロゲンを示し; R. はトリフルオロメチル基 またはハロゲンを示し;nはlである請求項1に記載のN 置換インドール誘導体。

【請求項6】一般式(3)

【化2】

[式中Ri、Ri、Ri およびnは請求項1で定義したものと 同じものを示す]で表される化合物を一般式(4) 【化3】

[式中X、R.およびR:は請求項1で定義したものと同じ ものを示し、ZはハロゲンまたはRu SO:を示し、Ru は置 換されていてもよい (こ~ )。のアルキル基または置換され ていてもよい(こ~)このアリール基を示す]で表される化 合物と縮合反応させることを特徴とするか、又は一般式 10 (2)

(化4)

[式中R:、R:、R:、Xおよびnは請求項1で定義した ものと同じものを示す〕で表される化合物を一般式・ (6)

 $R_1 COC1$  (6)

[式中Ri は請求項1で定義したものと同じものを示 す]、または一般式 (7)

 $(R_1 CO)_2 O$  (7)

[式中心は請求項1で定義したものと同じものを示す] で表される化合物と反応させることを特徴とする、一般 式(1)

【化5】

【式中Ri、Ri、Ri、Ri、Xおよびnは請求項1で定義 したものと同じものを示す]で表されるN置換インドー ル誘導体の製造法。

【請求項7】請求項1~5のいずれか1項に記載のN置 換インドール誘導体を有効成分として含有することを特 40 徴とする殺虫剤組成物。

【請求項8】殺虫剤組成物の適用がダニ目である請求項 7 記載の殺虫剤組成物。

項7記載の殺虫剤組成物。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は水田、畑地、果樹 **園、森林または環境衛生場面における害虫防除、人また** は動物の寄生虫防除に応用することのできるN置換イン

ドール誘導体、その製造法および組成物に関する。 [0002]

【従来の技術】米国特許出願第3290332号および特開昭5 5-151505にN置換インドール誘導体が記述されている が、これらは窒素上の置換基がアリールまたはピリジル 基は含まれておらず、またその寄生虫に対する防除活性 についても述べられていない。特開2000-26409において はN-アリール/ヘテロアリール置換の複素環物質が記述 されているが、インドール環上の置換基についてはアシ ル基等の置換基については述べられていない。米国特許 出願第5599774号にはN置換インドール誘導体が記載され ているが、本出願にはインドール環上にアシル基を置換 した化合物については記載されておらず、またその用途 は除草剤に限定されている。また、特開平6-92935にお けるN置換インドール誘導体はインドール環上にスルフ エニル基、スルファニル基またはスルフォニル基が結合 したものであり、インドール環上の3位にカルポニルの 結合した化合物については記載されていない。

[0003]

20

【発明が解決しようとする課題】農業分野および環境衛 生分野での有害生物防除においては、従来用いられてき た有機リン系殺虫剤、カーパメート系殺虫剤、ピレスロ イド系殺虫剤に対する抵抗性の発達が問題となってい る。一方では、哺乳動物、天敵昆虫、環境に対して安全 かつ負荷の少ないことも同時に要求されてきており、低 薬量で有効かつ安全な新規防除剤の開発が望まれてい る。また近年、公衆衛生の飛躍的な改善により、伝染病 やハエなどの衛生害虫発生率が大幅に減少したものの、 依然としてヒトやペット (イヌ、ネコ等)、家畜類 (ウ 30 シ、ブタ等)に寄生する寄生虫(ノミ、ダニ、線虫等) が問題となっている。これらを防除するための薬剤とし て、有機リン系殺虫剤、カーパメート系殺虫剤、ピレス ロイド系殺虫剤、IGR剤、フィプロニル、イミダクロプ リドなどの各種殺虫剤が使用されており、目的に応じて 商下液剤、噴霧剤、首輪、錠剤、チュアブル剤、顆粒 剤、細粒剤、粉剤、シャンプー・リンス剤などの製剤を 調整して使用している。しかしながらこれら防除剤は適 用動物に対して高い安全性を提供しているとはいえず、 またその防除効果および即効性の面に於いても、必ずし も十分ではない。

[0004]

【課題を解決するための手段】このような状況下、農業 客虫防除、衛生害虫防除、寄生虫防除に関して鋭意検討 を重ねた結果、一般式(1)で表される化合物群がこれ ら書虫に対して高い殺虫活性を示し、又動物への毒性が 低く安全性が高いことを見出し、本発明に至った。即ち 本発明は、〔1〕一般式(1)

[0005]

【化6】

れていてもよいい~いのアルキル基、置換されていても よい C. ~ C. のアルケニル基、置換されていてもよい C. ~ -Ciのアルキニル基、置換されていてもよいフェニル基、 置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基またはNR ; R: を示し ; R: はH、ハロゲンまたは置換されていてもよ いCi~Ciのアルキル基を示し; RiはH、置換されていて もよいい~いのアルキル基、置換されていてもよいい~ Ciのアルケニル基、置換されていてもよいCi~Ciのアル キニル基、置換されていてもよいい ~いのアルコキシ 基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NR rRs、ハロゲン、NO2、CN、CORs、CO2Rs、CONRrRs、SO2R SO: NR; Ra. SORs. SO: Rs. OCORs. OCO: Rs. OCONR ፣ Ra、OSO: Ra、置換されていてもよいフェニル基、置換 されていてもよいフェノキシ基、置換されていてもよい ヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテロア リールオキシ基を示し; Ra はH、置換されていてもよいC 1~6.のアルキル基、置換されていてもよい6.~6.のア ルコキシ基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチ オ基、NR: R:、ハロゲン、NO:、CN、COR、CO: Ro、CONR: Rs. SO: Rs. SO: NR: Rs. SORs. SO: Rs. OCORs. OCO: Rs. O CONR<sub>1</sub> R<sub>1</sub>、OSO<sub>2</sub> R<sub>2</sub>、置換されていてもよいフェニル基、 置換されていてもよいフェノキシ基、置換されていても よいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテ 30 ロアリールオキシ基を示し; R. はH、置換されていても よいい~いのアルキル基、置換されていてもよいい~い のアルコキシ基、NR: R:、ハロゲン、NO: またはCNを示 し; R. はHまたはハロゲンを示し; R.、R. およびR. はそ れぞれ独立にH、置換されていてもよいCi~Ciのアルキ ル基または置換されていてもよいフェニル基を示すが、 R: およびR: で5~6員環を形成してもよく; nは1、2、3ま たは4を示す。]で表されるN置換インドール誘導体、

【0007】 (2) XがN. CF、CCIまたはCBrを示し;R」は置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基またはNR:Riを示し;RiはHまたは置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基を示し;RiはH、置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基、ハロゲン、NO:またはCNを示し;Riは置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NR:Riまたはハロゲンを示し;Riは置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NR:Riまたはハロゲンを示し;Riは置換されていてもよいCi~Ciのアルキルチオ基、NR:Riまたはハロゲンを示し;Riは置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、

ルコキシ基、ハロゲン、NO: またはCNを示し; R: 、R: およびR: はそれぞれ独立にR: 置換されていてもよいC:  $\sim C$ : のアルキル基または置換されていてもよいフェニル基を示すが、R: およびR: で5~7 負環を形成してもよく; nはR: 2またはR: で5~7 しに記載のR: のR: の

【0008】 (3) XがNまたはCCIを示し; R. は置換されていてもよいC. ~C. のアルキル基を示し; R. はHまたは置換されていてもよいC. ~C. のアルキル基を示し; R. は H. 置換されていてもよいC. ~C. のアルキル基、置換されていてもよいC. ~C. のアルコキシ基、ハロゲン、NO: またはCNを示し; R. は置換されていてもよいC. ~C. のアルキル基、置換されていてもよいC. ~C. のアルキル基、置換されていてもよいC. ~C. のアルコキシ基またはハロゲンを示し; R. は置換されていてもよいC. ~C. のアルコキシ基またはハロゲンを示し; nはlまたは2である [1] に記載のN置換インドール誘導体、

【0009】 [4] XがNまたはCCIを示し;  $R_1$  はハロゲンで置換されていてもよい $C_1$   $\sim$   $C_2$  のアルキル基を示し;  $R_2$  は $R_3$  たは $R_3$  たは $R_4$  たは $R_5$  になって、のアルキル基、ハロゲンで置換されていてもよい $R_5$  にのアルコキシ基またはハロゲンを示し;  $R_5$  はハロゲンで置換されていてもよい $R_5$  ないって、のアルコキシ基またはハロゲンを示し;  $R_5$  はハロゲンで置換されていてもよい $R_5$  ないのアルコキシ基またはハロゲンを示し;  $R_5$  はハロゲンで置換されていてもよい $R_5$  ないのアルコキシ基またはハロゲンを示し;  $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  に記載の $R_5$  の $R_5$  に $R_5$ 

【0010】 [5] XがNまたはCCIを示し;Riはトリフルオロメチル基を示し;RiはHまたはメチル基を示し;RiはH、メチル基、トリフルオロメチル基またはハロゲンを示し;Riはハロゲンを示し;Riはトリフルオロメチル基またはハロゲンを示し;nはIである[1] に記載のN置換インドール誘導体、

【0011】 (6) 一般式 (3)

【化7】

【0012】 [式中R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびnは〔1〕で定義 したものと同じものを示す] で表される化合物を一般式 (4)

[0013]

【化8】

ናበ

40

【0014】〔式中X、R」およびR,は〔1〕で定義した ものと同じものを示し、ZはハロゲンまたはRio SO: を示 し、Rio は置換されていてもよいCi~Coのアルキル基ま たは置換されていてもよいい~いのアリール基を示す] で表される化合物と縮合反応させることを特徴とする か、又は

【0015】一般式(2)

【化9】

【0016】 [式中R:、R:、R:、R:、Xおよびnは〔1〕 で定義したものと同じものを示す]で表される化合物を 一般式(6)

 $R_1 COCI$  (6)

[式中Rnは〔1〕で定義したものと同じものを示す]、 または一般式(7)

 $(R_1 CO)_2 O$  (7)

[式中Riは〔1〕で定義したものと同じものを示す]で 表される化合物と反応させることを特徴とする、一般式 (1)

[0017]

(化10)

$$(R_2)_n \xrightarrow{\mathbb{R}_1} R_2$$

$$X \xrightarrow{R_3} R_4$$

$$R_3 \qquad (1)$$

. [式中Ri、Ri、Ri、Ri、Ri、Xおよびnは〔1〕で定義し たものと同じものを示す]で表されるN置換インドール 誘導体の製造法、

【0018】 (7) 前記 [1] ~ [5] のいずれか1項 に記載のN置換インドール誘導体を有効成分として含有 することを特徴とする殺虫剤組成物、

【0019】〔8〕殺虫剤組成物の適用がダニ目である 〔7〕記載の殺虫剤組成物、〔9〕殺虫剤組成物の適用 がネコノミである〔7〕 記載の殺虫剤組成物に関する。

【0020】次に本発明にかかる一般式(1)~

(4)、(6)~(7)における置換基X、Ri~Rii、Z およびnの定義について説明する。

おけるRi は、置換されていてもよいCi ~Ci のアルキル 基、置換されていてもよいC: ~C: のアルケニル基、置換 されていてもよいい~いのアルキニル基、置換されてい てもよいフェニル基、置換されていてもよいい~いのア ルキルチオ基またはNR: R: を示す。

【0022】Rにおける「置換されていてもよいい~C のアルキル基」の「Ci~Ciのアルキル基」としては、例 えば直鎖または分鎖のい~0のアルキル基であって、そ の好適な置換基としてはハロゲンが挙げられ、その具体 10 例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソブ ロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘ . キシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブ ロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられる。 R<sub>1</sub> における「置換されていてもよいC<sub>2</sub> ~ C<sub>4</sub> のアルケニル 基」の「C: ~C: のアルケニル基」としては、例えば直鎖 または分類のい~いのアルケニル基であって、その好適 な置換基としてはハロゲンが挙げられ、具体例として は、ビニル基、トリクロロビニル基、アリル基、イソプ ロペニル基、ブテニル基、ペンテニル基、ヘキセニル 20 基、スチリル基などが挙げられる。R<sub>1</sub> における「置換さ れていてもよい(:~ (: のアルキニル基」の「(: ~ (: のア ルキニル基」としては、例えば直鎖または分鎖の0.~0.・ のアルキニル基であって、その好適な置換基としてはハ ロゲンが挙げられ、具体例としては、エチニル基、プロ ピニル基、プチニル基、ペンチニル基などが挙げられ

【0023】Rにおける「置換されていてもよいフェニ ル基」の好適な置換基としてはハロゲン、水酸基、Ci~ Caのアルキル基、ハロゲノCi~Caのアルキル基、Ci~Ca 30 のアルコキシ基、ハロゲノ() ~() のアルコキシ基、ベン ジルオキシ、フェノキシ等が挙げられ、具体例として は、フェニル基、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニ ル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル 基、メトキシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、 ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェ ニル基、フェノキシフェニル基などが挙げられる。Riに おける「置換されていてもよい(」~(」のアルキルチオ 基」の「Cı~Cıのアルキルチオ基」としては、例えば直 鎖または分鎖の()~()のアルキルチオ基であって、その 40 好適な置換基としてはハロゲン、フェニルが挙げられ、 具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基、プロピ ルチオ基、プチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチ オ基、ペンジルチオ基、トリクロロメチルチオ基、モノ フルオロジクロロメチルチオ基などが挙げられる。Riは 好ましくはメチル基、イソプロピル基、lerl-ブチル 基、クロロメチル基、トリフルオロメチル基、トリクロ ロメチル基、ビニル基、スチリル基、フェニル基などが 挙げられ、特に好ましくはトリフルオロメチル基であ

【0021】一般式 (1)、 (3)、 (6) ~ (7) に 50 【0024】一般式 (1) ~ (3) におけるReは、H、

ハロゲンまたは置換されていてもよい(こ~(このアルキル 基を示す。 凡 における「置換されていてもよい() ~ (, の アルキル基」とはRiにおける場合と同様であり、その具 体例としては、メチル基、エチル基、プロビル基、イソ プロピル基、プチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、 ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、 プロモメチル基、トリクロロメチル基などが挙げられ る。R.は、好ましくは、Hまたはメチル基である。

【0025】一般式 (1) ~ (3) におけるR.は、H. 置換されていてもよいい~いのアルキル基、置換されて いてもよい(:~ いアルケニル基、置換されていてもよ いい~にのアルキニル基、置換されていてもよいに~に のアルコキシ基、置換されていてもよいアルキルチオ 基、NR፣ Rε、ハロゲン、NO:、CN、COR•、CO: R•、CONR 7 Rs., SO1 Rs., SO2 NR7 Rs., SOR9., SO2 Rs., OCORs., OCO2 Rs., OCONR, R:、OSO: R,、置換されていてもよいフェニル基、 置換されていてもよいフェノキシ基: 置換されていても よいヘテロアリール基または置換されていてもよいヘテ ロアリールオキシ基を示す。R: における「置換されてい てもよいCi~Ciのアルキル基」とはRiにおける場合と同 20 様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、 プロビル基、イソプロビル基、ブチル基、tert-ブチル 基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、 クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメチル 基、ベンジル基などが挙げられる。Riにおける「置換さ れていてもよいC:~C。のアルケニル基」とはRiにおける 場合と同様であり、その具体例としてはピニル基、アリ ル基、イソプロペニル基、プテニル基、ペンテニル基、 ヘキセニル基、スチリル基などが挙げられる。

【0026】 R: における「置換されていてもよいC: ~ C。 のアルキニル基」とはRiにおける場合と同様であり、そ の具体例としてはエチニル基、プロピニル基、プチニル 基、ペンチニル基などが挙げられる。R. における「置換 されていてもよいい~いのアルコキシ基」の「い~いの アルコキシ基」とは、例えば直鎖または分鎖のCi~Ciの アルコキシ基であって、その好適な置換基としてはハロ ゲン、フェニルが挙げられ、具体例としてはメトキシ 基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブ トキシ基、tert-ブトキシ基、トリフルオロメトキシ 基、ベンジルオキシ基などが挙げられる。Riにおける 「置換されていてもよいい~いのアルキルチオ基」とは Ri における場合と同様であり、その具体例としてはメチ ルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、ブチルチオ 基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、ペンジルチオ 基、トリクロロメチルチオ基、モノフルオロジクロロメ チルチオ基などが挙げられる。

【0027】Riにおける「NRiRi」、「CONRiRi」、「SO , NR; Ri」および「OCONR; Ri」のR; とRiは、それぞれ独立 にH、置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基または

5~6員環を形成してもよい。「嚴換されていてもよいC」 ~C のアルキル基」とはR」での場合と同様であり、具 体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプ ロビル基、プチル基、tert-プチル基、ペンチル基、へ キシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブ ロモメチル基、トリクロロメチル基、ペンジル基などが 挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とは R, での場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシ フェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、ト リフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、te rt-プトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、 トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル 基などが挙げられる。また、RiおよびRiによって形成で きる5~6負環の具体例としては、ピロリジニル基、ピペ リジニル基、モルホリノ基などが挙げられる。「NR r Ru 」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、 ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ 基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチル アミノ基、lert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、 ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モル ホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。「CONR, R.I. の具体例としてはメチルアミノカルボニル基、ジメチル アミノカルボニル基、エチルアミノカルボニル基、ジエ チルアミノカルポニル基、ピロリジノカルポニル基、ピ ペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、アニ リノカルボニル基などが挙げられる。「SO: NR: Ri」の具 体例としてはスルファモイル基、メチルスルファモイル 基、ジメチルスルファモイル基、エチルスルファモイル 基、ジエチルスルファモイル基、プロピルスルファモイ ル基、イソプロピルスルファモイル基、プチルスルファ モイル基、tert-ブチルスルファモイル基、ペンチルス ルファモイル基、ヘキシルスルファモイル基、ピロリジ ノスルファモイル基、ピペリジノスルファモイル基、モ ルホリノスルファモイル基、アニリノスルファモイル基 などが挙げられる。「OCONR, R.」の具体例としては、メ チルアミノカルポニルオキシ基、ジメチルアミノカルポ ニルオキシ基、エチルアミノカルポニルオキシ基、ジェ チルアミノカルポニルオキシ基、ピロリジノカルポニル オキシ基、ピペリジノカルポニルオキシ基、モルホリノ カルポニルオキシ基、アニリノカルポニルオキシ基など が挙げられる。

【0028】Riにおける「ハロゲン」としてはフッ素、 塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。R:における「CO´ Roj, [CO: Roj, [SO: Roj, [SORoj, [SO: Roj, 「OCOR,」、「OCO: R,」および「OSO: R,」のR,は、R,は それぞれ独立にH、置換されていてもよいCı~Cıのアル キル基または置換されていてもよいフェニル基を示す。 「置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基」とはRi での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチ 置換されていてもよいフェニル基を示し、R:およびRiで 50 ル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-

30

11 ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチ ル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメ チル基、ベンジル基などが挙げられる。「置換されてい てもよいフェニル基」とはR」での場合と同様であり、 具体例としてはヒドロキシフェニル基、クロロフェニル 基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル 基、メトキシフェニル基、tert-プトキシフェニル基、 ベンジルオキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェ ニル基、フェノキシフェニル基などが、それぞれ例示で きる。「COR」の具体例としては、ホルミル基、アセチ ル基、トリフルオロアセチル基、トリクロロアセチル 基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バ レリル基、ピバロイル基、ベンゾイル基、トルオイル 基、フラノイル基、ニコチノイル基、イソニコチノイル 基、シンナモイル基などが挙げられる。「CO:R,」の具 体例としては、メトキシカルボニル基、エトキシカルボ ニル基、プロポキシカルポニル基、プトキシカルポニル 基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンジルオキシカル ボニル基、フェノキシカルポニル基などが、「SO: Ro」 の具体例としては、メトキシスルフォニル基、エトキシ スルフォニル基、プロポキシスルフォニル基、ブトキシ スルフォニル基、ペンジルオキシスルフォニル基、フェ ノキシスルフォニル基などが、「SOR。」の具体例として は、メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プ ロピルスルフィニル基、プチルスルフィニル基、ペンジ ルスルフィニル基、フェニルスルフィニル基などが挙げ られる。「SO: Ro」の具体例としては、メチルスルフォ ニル基、エチルスルフォニル基、プロピルスルフォニル 基、プチルスルフォニル基、ベンジルスルフォニル基、 フェニルスルフォニル基などが挙げられる。「OCOR。」 の具体例としては、アセチルオキシ基、プロピオニルオ キシ基、プチリルオキシ基、イソプチリルオキシ基、バ レリルオキシ基、ピパロイルオキシ基、ベンゾイルオキ シ基、トルオイルオキシ基、フラノイルオキシ基、ニコ チノイルオキシ基、イソニコチノイルオキシ基、シンナ モイルオキシ基などが挙げられる。「OCO: R.」の具体例 としては、メトキシカルポニルオキシ基、エトキシカル ポニルオキシ基、プロポキシカルポニルオキシ基、プト キシカルポニルオキシ基、tert-ブトキシカルポニルオ キシ基、ベンジルオキシカルポニルオキシ基、フェノキ シカルボニルオキシ基などが挙げられる。「OSO: Ro」の 具体例としては、メタンスルフォニルオキシ基、エタン スルフォニルオキシ基、プロパンスルフォニルオキシ 基、プタンスルフォニルオキシ基、ペンタンスルフォニ ルオキシ基、ヘキサンスルフォニルオキシ基、ベンゼン スルフォニルオキシ基、トルエンスルフォニルオキシ基 などが挙げられる。

【0029】R<sub>1</sub>における「置換されていてもよいフェニル基」とはR<sub>1</sub>における場合と同様であり、その具体例としては、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メ 50

チルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メト キシフェニル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジル オキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、 フェノキシフェニル基などが挙げられる。R: における 「置換されていてもよいフェノキシ基」の好適な置換基 としてはハロゲン、水酸基、Ci~Ciのアルキル基、ハロ ゲノCi~Ciのアルキル基、Ci~Ciのアルコキシ基、ハロ ゲノCI~CIのアルコキシ基、フェノキシ等が挙げられ、 具体例としては、フェノキシ基、ヒドロキシフェノキシ 基、クロロフェノキシ基、メチルフェノキシ基、トリフ ルオロメチルフェノキシ基、メトキシフェノキシ基、ト リフルオロメトキシフェノキシ基、フェノキシフェノキ シ基などが挙げられる。Riにおける「置換されていても よいヘテロアリール基」の「ヘテロアリール」とは環上 にO、S、N等を有す1~3環の複素芳香環基を示し、 置換基として例えばCi~Ciのアルキル基、ハロゲン等に よって置換されてもよく、具体例としては、フラニル 基、チエニル基、アゾリル基、ピリジル基、インドリル 基等が挙げられる。置換されていてもよいヘテロアリー ルオキシ基としてはの「ヘテロアリールオキシ基」とは 環上にO、S、N等を有す1~3環の複素芳香環水酸基 を示し、置換基として例えばCi~Ciのアルキル基、ハロ ゲン等によって置換されてもよく、具体例としては、ア ゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、インドリルオキシ 基などが挙げられる。Riは好ましくは、H;メチル基、t ert-ブチル基、トリフルオロメチル基などの置換されい てもよいCi~Ciのアルキル基;F、Clなどのハロゲン; または、メトキシ基、トリフルオロメトキシ基などの置 換されいてもよいCi~Ciのアルコキシ基であり、特に好 ましくはH、メチル基、トリフルオロメチル基、F、Clで

【0030】RiはH、置換されていてもよいCi~Ciのア ルキル基、置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ 基、置換されていてもよいアルキルチオ基、NR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>、ハ ロゲン、NO:、CN、COR:、CO: R:、CONR: R:、SO: R:、SO: N R: Rs. SORs. SO: Rs. OCORs. OCO: Rs. OCONR: Rs. OSO gRo、 置換されていてもよいフェニル基、置換されてい てもよいフェノキシ基、置換されていてもよいヘテロア リール基または置換されていてもよいヘテロアリールオ キシ基を示す。Riにおける「置換されていてもよいCi~ Caのアルキル基」とはRaにおける場合と同様であり、そ の具体例としては、メチル基、エチル基、プロピル基、 イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル 基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル 基、プロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基 などが挙げられる。Riにおける「置換されていてもよい Ci~Ciのアルコキシ基」とはRiにおける場合と同様であ り、その具体例としては、メトキシ基、エトキシ基、ブ ロポキシ基、イソプロポキシ基、プトキシ基、tert-ブ トキシ基、トリフルオロメトキシ基、ベンジルオキシ基

などが挙げられる。R. における「置換されていてもよい C. ~C. のアルキルチオ基」とはR. における場合と同様であり、その具体例としては、メチルチオ基、エチルチオ基、プロビルチオ基、ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、ベンジルチオ基、トリクロロメチルチオ基、モノフルオロジクロロメチルチオ基などが挙げられる。

【0031】R.における「NR.R.」、「CONR.R.」、「SO : NR; R:」および「OCONR; R:」のR; とR: は、それぞれ独立 にH、 置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~C<sub>4</sub> のアルキル基または 置換されていてもよいフェニル基を示し、Rī およびRi で 5~6員環を形成してもよい。「置換されていてもよいC ~Caのアルキル基」とはRi での場合と同様であり、具 体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプ ロビル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘ キシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブ ロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基などが 挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とは Riでの場合と同様であり、具体例としてはヒドロキシ フェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニル基、ト リフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、te rl-プトキシフェニル基、ベンジルオキシフェニル基、 トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシフェニル 基などが挙げられる。また、Ri およびRL によって形成で きる5~6員環の具体例としては、ピロリジニル基、ピペ リジニル基、モルホリノ基などが挙げられる。「NR rRs」の具体例としては、アミノ基、メチルアミノ基、 ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ 基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、プチル アミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、 ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ基、モル ホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。「CONR: Ra」 の具体例としては、メチルアミノカルボニル基、ジメチ ルアミノカルポニル基、エチルアミノカルポニル基、ジ エチルアミノカルボニル基、ピロリジノカルボニル基、 ピペリジノカルボニル基、モルホリノカルボニル基、ア ニリノカルボニル基などが挙げられる。「SO:NR:Ra」の 具体例としては、スルファモイル基、メチルスルファモ イル基、ジメチルスルファモイル基、エチルスルファモ イル基、ジエチルスルファモイル基、プロピルスルファ モイル基、イソプロピルスルファモイル基、ブチルスル ファモイル基、tert-プチルスルファモイル基、ペンチ ルスルファモイル基、ヘキシルスルファモイル基、ピロ リジノスルファモイル基、ピペリジノスルファモイル 基、モルホリノスルファモイル基、アニリノスルファモ イル基などが挙げられる。「OCONR: Ri」の具体例として は、メチルアミノカルポニルオキシ基、ジメチルアミノ カルポニルオキシ基、エチルアミノカルポニルオキシ 基、ジエチルアミノカルポニルオキシ基、ピロリジノカ ルポニルオキシ基、ピペリジノカルポニルオキシ基、モ 50 ルホリノカルボニルオキシ基、アニリノカルボニルオキシ基などが挙げられる。

【0032】Rいにおける「ハロゲン」としてはフッ素、 塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。Riにおける「CO  $R_{\bullet}$ ],  $[CO_{\circ}R_{\bullet}]$ ,  $[SO_{\circ}R_{\bullet}]$ ,  $[SO_{\circ}R_{\bullet}]$ , 「OCOR,」、「OCO: R,」および「OSO: R,」のR,は、R,は それぞれ独立にH、置換されていてもよいCi~Ciのアル キル基または置換されていてもよいフェニル基を示す。 「置換されていてもよい(、~ (、のアルキル基」とはR、 での場合と同様であり、具体例としてはメチル基、エチ ル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチ ル基、クロロメチル基、プロモメチル基、トリクロロメ チル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェ ニル基」とはR: での場合と同様であり、具体例として はヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフ ェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフ ェニル基、tert-プトキシフェニル基、ペンジルオキシ フェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノ キシフェニル基などが例示できる。「COR。」の具体例と しては、ホルミル基、アセチル基、トリフルオロアセチ ル基、トリクロロアセチル基、プロピオニル基、ブチリ ル基、イソプチリル基、パレリル基、ピパロイル基、ベ ンゾイル基、トルオイル基、フラノイル基、ニコチノイ ル基、イソニコチノイル基、シンナモイル基などが挙げ られる。「CO: Ro」の具体例としては、メトキシカルボ ニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル 基、プトキシカルポニル基、tert-プトキシカルポニル 基、ベンジルオキシカルボニル基、フェノキシカルボニ ル基などが挙げられる。「SO: Rol の具体例としては、 メトキシスルフォニル基、エトキシスルフォニル基、プ ロポキシスルフォニル基、ブトキシスルフォニル基、ベ ンジルオキシスルフォニル基、フェノキシスルフォニル 基などが挙げられる。「SOR」の具体例としては、メチ ルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルス ルフィニル基、プチルスルフィニル基、ベンジルスルフ ィニル基、フェニルスルフィニル基などが挙げられる。 「SO: Ro」としてはメチルスルフォニル基、エチルスル フォニル基、プロピルスルフォニル基、プチルスルフォ ニル基、ベンジルスルフォニル基、フェニルスルフォニ ル基などが挙げられる。「OCOR,」の具体例としては、 アセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、プチリルオ キシ基、イソブチリルオキシ基、パレリルオキシ基、ビ パロイルオキシ基、ベンゾイルオキシ基、トルオイルオ キシ基、フラノイルオキシ基、ニコチノイルオキシ基、 イソニコチノイルオキシ基、シンナモイルオキシ基など が挙げられる。「OCO: Ro」としては、メトキシカルボニ ルオキシ基、エトキシカルポニルオキシ基、プロポキシ カルポニルオキシ基、プトキシカルポニルオキシ基、te rt-プトキシカルポニルオキシ基、ペンジルオキシカル

ある。

ボニルオキシ基、フェノキシカルボニルオキシ基などが 挙げられる。「OSO: R.」の具体例としては、メタンスル フォニルオキシ基、エタンスルフォニルオキシ基、プロ パンスルフォニルオキシ基、ブタンスルフォニルオキシ 基、ペンタンスルフォニルオキシ基、ヘキサンスルフォ ニルオキシ基、ペンゼンスルフォニルオキシ基、トルエ ンスルフォニルオキシ基などが挙げられる。

【0033】Rいにおける「置換されていてもよいフェニ ル基」とはRiにおける場合と同様であり、その具体例と しては、ヒドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メ チルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メト キシフェニル基、lert-ブトキシフェニル基、ベンジル オキシフェニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、 フェノキシフェニル基などが挙げられる。Riにおける 「置換されていてもよいフェノキシ基」とはRiにおける 場合と同様であり、その具体例としては、フェノキシ 基、ヒドロキシフェノキシ基、クロロフェノキシ基、メ チルフェノキシ基、トリフルオロメチルフェノキシ基、 メトキシフェノキシ基、トリフルオロメトキシフェノキ シ基、フェノキシフェノキシ基などが挙げられる。Ric おける「置換されていてもよいヘテロアリール基」とは R. における場合と同様であり、その具体例としては、フ ラニル基、チエニル基、アゾリル基、ピリジル基、イン ドリル基が挙げられ、置換されていてもよいヘテロアリ ールオキシ基とはRiにおける場合と同様であり、その具 体例としては、アゾリルオキシ基、ピリジルオキシ基、 インドリルオキシ基などが挙げられる。Raは好ましく は、H;メチル基、tert-ブチル基、トリフルオロメチル 基などの置換されいてもよいG~Gのアルキル基;F、C lなどのハロゲン; または、メトキシ基、トリフルオロ ・メトキシ基などの置換されいてもよいい ~このアルコキ シ基であり、特に好ましくはClである。

【0034】一般式 (1)~(2)、(4)におけるRiはH、 個換されていてもよいCi~Gのアルキル基、 個換されていてもよいCi~Gのアルコキシ基、 NRi Ri、ハロゲン、 NO: またはCNを示す。Ri における「個換されていてもよいCi~Gi のアルキル基」とはRi における場合と同様であり、その具体例としては、メチル基、エチル基、ブロピル基、イソプロピル基、ブチル基、 tert-ブチル基、ペンチル基、 ブロモメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、トリクロロメチル基はどが挙げられる。Ri における「 個換されていてもよい Ci~Gi のアルコキシ基」とはRi における場合と同様であり、その具体例としては、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、 tert-ブトキシ基、トリフルオロメトキシ基、ベンジルオキシ基などが挙げられる。

【0035】 $R_1$ における「 $NR_1$ R\_1」の $R_1$ と $R_2$ は、それぞ 例示できる。「 $R_{11}$ S $0_1$ 」の具体例としては、メタれ独立に $R_1$ 、置換されていてもよい $R_1$ 、 $R_2$  フォニルオキシ基、ペンゼンスルフォニルオキシまたは置換されていてもよいフェニル基を示し、 $R_1$ およ  $R_2$  ルエンスルフォニルオキシ基などが挙げられる。

16 びR:で5~6員環を形成してもよい。「置換されていても よいC:~C:のアルキル基」とはR:での場合と同様であ

り、具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ヘキシル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ブロモメチル基、トリクロロメチル基、ベンジル基

などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはRi での場合と同様であり、具体例としてはヒ

ドロキシフェニル基、クロロフェニル基、メチルフェニ 10 ル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニ

ル基、tert-ブトキシフェニル基、ベンジルオキシフェ ニル基、トリフルオロメトキシフェニル基、フェノキシ

フェニル基などが例示できる。、また、Rr およびRe によ

って形成できる5~6員環の具体例としては、ピロリジニル基、ピペリジニル基、モルホリノ基などが挙げられ

る。「NR: Re」の具体例としては、アミノ基、メチルア

ミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチル

アミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、 プチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミ

ノ基、ヘキシルアミノ基、ピロリジノ基、ピペリジノ 基、モルホリノ基、アニリノ基などが挙げられる。

【0036】R:における「ハロゲン」としては、フッ素、塩素、臭素、ヨウ素が挙げられる。R:は好ましくは、F、CI、Br、Iなどのハロゲン、トリフルオロメチル基などの置換されていてもよいCi~Ciのアルキル基、または、トリフルオロメトキシ基などの置換されていてもよいCi~Ciのアルコキシ基であり、特に好ましくはCI、

トリフルオロメチル基である。

【0037】一般式 (1) ~ (2) 、 (4) におけるX はNまたはCR を示し、R はHまたはハロゲンを示す。R における「ハロゲン」としては、F、CI、Br、Iが挙げられる。Xは好ましくは、NまたはCC1 である。一般式 (1) 、 (2) 、 (3) におけるnは1 ~ 4 の整数であり、好ましくは1または2であり、特に好ましくは1で

【0038】一般式(4)におけるZは、ハロゲンまたはRin SOi を示し、「ハロゲン」としては例えばCl、Br、Iなどが挙げられる。Zにおける「Rin SOi」のRin は、置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよいフェニル基を示す。「置換されていてもよいフェニル基」とはRiにおける場合と同様であり、その具体例としてはメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、tert-ブチル基などが挙げられる。「置換されていてもよいフェニル基」とはRi での場合と同様であり、具体例としてはクロロフェニル基、メチルフェニル基、トリフルオロメチルフェニル基、メトキシフェニル基、フェニル基などがそれぞれ例示できる。「Rin SOi」の具体例としては、メタンスルフォニルオキシ基、ベンゼンスルフォニルオキシ基、トルエンスルフォニルオキシ基などが挙げられる。

17

【0039】一般式 (1) の好ましい化合物としては表 \* [0041] 1に示す化合物が挙げられる。

[0040]表1

【化11]

$$\begin{array}{c} 0 \\ R_1 \\ R_2 \\ R_3 \end{array} \qquad (1)$$

\* 10

21 N C (CH <sub>3</sub> ) 1 H 5-F C1 CF <sub>3</sub> 1 22 N cyclopropyl H 5-OCH <sub>2</sub> C1 CF <sub>3</sub> 1 23 N cyclohexyl H 5-NO <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 24 N CF <sub>3</sub> H 5-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 25 N CC1 <sub>2</sub> H 5-CH <sub>3</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 26 N CC1 <sub>3</sub> -CC1 <sub>2</sub> H 5-Br C1 CF <sub>4</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 5-C1, 6-C1 C1 CF <sub>4</sub> 2 28 N 4-C1-C <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-F CH <sub>3</sub> CF <sub>4</sub> 1 29 N NH <sub>2</sub> H 6-Br C1 CF <sub>4</sub> 1 30 N NHCH <sub>4</sub> H 6-CH <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 31 N N (CH <sub>3</sub> ) 2 H 6-CN OCH <sub>4</sub> CF <sub>4</sub> 1 32 N N (C2H <sub>3</sub> ) 2 H 6-NO <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-OCH <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 34 N SCH <sub>3</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 35 CC1 CH <sub>4</sub> H H C1 OCF <sub>4</sub> 1	_							
2 N C2Hs H H C1 CF: 1 3 N CH(CH:): H H C1 CF: 1 4 N C(CH:): H H C1 CF: 1 5 N cyclopropyl CH: H C1 CF: 1 6 N cyclohexyl H H C1 CF: 1 7 N CF: H H C1 CF: 1 8 N CC1: H H C1 CF: 1 9 N CC1=CC1: H H C1 CF: 1 10 N C4H: H H C1 CF: 1 11 N 4-C1-C4H: H H C7: CF: 1 12 N NH: H H C7: CF: 1 13 N NHCH: H H F C7: CF: 1 14 N N(CH:): H H F C7: CF: 1 15 N N(C2H:): H H C7: CF: 1 16 N NHC: H H C7: CF: 1 17 N SCH: H H C7: CF: 1 18 N CH: H H C7: CF: 1 19 N C2H: H H C7: CF: 1 10 N C4H: H T C7: CF: 1 11 N C1 C7: C7: 1 12 N NH: H C7: C7: 1 13 N NHCH: CH: H C7: C7: 1 14 N N(CH:): H H C7: C7: 1 15 N N(C2H:): H H C7: C7: 1 16 N NHC: H H C7: C7: 1 17 N SCH: H H C7: C7: 1 18 N CH: H S-C1 C1 CF: 1 19 N C2H: H S-C1 C1 CF: 1 20 N CH(CH:): H S-Br C1 CF: 1 21 N C(CH:): H S-Br C1 CF: 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH: C1 CF: 1 23 N Cyclohexyl H S-NO: C1 CF: 1 24 N CF: H S-C1 C1 CF: 1 25 N C1: H S-C1 C1 CF: 1 26 N C1=CC1: H S-Br C1 CF: 1 27 N C4H: H S-C1 C1 CF: 1 28 N 4-C1-C4H: H S-C1 C1 CF: 1 29 N NH: H S-C1 C1 CF: 1 20 N NCH: H S-C1 C1 CF: 1 21 N C4H: H S-C1 C1 CF: 1 22 N N C4H: H S-C1 C1 CF: 1 23 N NHCH: H S-C1 C1 CF: 1 24 N CF: C1 CF: 1 25 N C1: C7: 1 26 N C1=CC1: H S-Br C1 CF: 1 27 N C4H: H S-C1 C1 CF: 1 28 N 4-C1-C4H: H S-C1 C1 CF: 1 30 N NHCH: H S-C1 C1 CF: 1 31 N N(CH:): H S-C1 C1 CF: 1 32 N N(C2H:): H S-C1 C1 CF: 1 33 N NHC+H H S-C1 C1 CF: 1 34 N SCH: H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH: H H C1 C1 CF: 1	No	X	Rı	R:	R:	R <sub>4</sub>	Rs	B
3 N CH(CH <sub>1</sub> ): H H CI CF <sub>1</sub> 1 4 N C(CH <sub>1</sub> ): H H CI CF <sub>1</sub> 1 5 N Cyclopropyl CH <sub>1</sub> H CI CF <sub>1</sub> 1 6 N Cyclohexyl H H CI CF <sub>1</sub> 1 7 N CF <sub>2</sub> H H CI CF <sub>1</sub> 1 8 N CCl <sub>1</sub> H H CI CF <sub>2</sub> 1 9 N CCl <sub>2</sub> CCl <sub>2</sub> H H CI CF <sub>1</sub> 1 10 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H H Br CF <sub>2</sub> 1 11 N 4-Cl-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H H Br CF <sub>2</sub> 1 12 N NH <sub>2</sub> H H CF <sub>3</sub> CF <sub>4</sub> 1 13 N NHCH <sub>4</sub> CH <sub>5</sub> H F CYclohexyl 1 14 N N(CH <sub>2</sub> ): H H F CYClohexyl 1 15 N N(C2H <sub>3</sub> ): H H I CCF <sub>4</sub> CF <sub>4</sub> 1 16 N NHC <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H H CF <sub>5</sub> CF <sub>4</sub> 1 17 N SCH <sub>2</sub> H H CF <sub>5</sub> CF <sub>4</sub> 1 18 N CH <sub>4</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 19 N C2H <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 19 N C2H <sub>5</sub> H S-CN CI CF <sub>5</sub> 1 20 N CH(CH <sub>2</sub> ): H S-Br CI CF <sub>5</sub> 1 21 N C(CH <sub>4</sub> ): H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH <sub>4</sub> CI CF <sub>5</sub> 1 23 N Cyclohexyl H S-NO <sub>5</sub> CI CF <sub>5</sub> 1 24 N CF <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 25 N CCl <sub>2</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 26 N CCl <sub>3</sub> CCl <sub>4</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 28 N 4-CI-C <sub>4</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 29 N NH <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 20 N NHCH <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 21 N C <sub>4</sub> CH <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 22 N Cyclopexyl H S-OCH <sub>6</sub> CI CF <sub>5</sub> 1 23 N Cyclohexyl H S-NO <sub>5</sub> CI CF <sub>5</sub> 1 24 N CF <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 25 N CCl <sub>2</sub> H S-Br CI CF <sub>5</sub> 1 26 N CCl <sub>2</sub> CH <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 28 N 4-CI-C <sub>4</sub> H S-CI CI CF <sub>5</sub> 1 30 N NHCH <sub>5</sub> H S-CN CI CF <sub>5</sub> 1 31 N N(CH <sub>5</sub> ): H S-CN CI CF <sub>5</sub> 1 32 N N(C2H <sub>5</sub> ): H S-CN CI CF <sub>5</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H S-CN CI CF <sub>5</sub> 1 34 N SCH <sub>5</sub> H 4-CI CI CF <sub>5</sub> 1 35 CCI CH <sub>5</sub> H H CI CCF <sub>5</sub> 1	-					· C1	CI	1
4 N C (Ch <sub>1</sub> ): H H C1 CF: 1  5 N Cyclopropyl CH: H C1 CF: 1  6 N Cyclohexyl H H C1 CF: 1  7 N CF: H H C1 CF: 1  8 N CC1: H H C1 CF: 1  10 N C: H: H C1 CF: 1  11 N 4-C1-C: H: H H C1 CF: 1  12 N NH: H H CF: CF: 1  13 N NHCH: H H CF: CF: 1  14 N N (CH:): H H CF: CF: 1  15 N (C2H:): H H CF: CF: 1  16 N NHC: H: H CF: CF: 1  17 N SCH: H H CF: CF: 1  18 N CH: H CF: CF: 1  19 N C2H: H S-CN C1 CF: 1  20 N CH (CH:): H S-Br C1 CF: 1  21 N C (CH:): H S-Br C1 CF: 1  22 N Cyclopropyl H S-CH: C1 CF: 1  23 N Cyclohexyl H S-NO: C1 CF: 1  24 N CF: H S-CH: C1 CF: 1  25 N CC1: H S-CH: C1 CF: 1  26 N CC1-CC1: H S-Br C1 CF: 1  27 N C: H: H S-CH: C1 CF: 1  28 N CF: H S-CH: C1 CF: 1  29 N NH: H S-CH: C1 CF: 1  20 N CH(CH:): H S-Br C1 CF: 1  21 N C (CH:): H S-Br C1 CF: 1  22 N Cyclohexyl H S-NO: C1 CF: 1  23 N Cyclohexyl H S-CH: C1 CF: 1  24 N CF: H S-CH: C1 CF: 1  25 N CC1: H S-CH: C1 CF: 1  26 N CC1-CC1: H S-Br C1 CF: 1  27 N C: H: H S-CH: C1 CF: 1  28 N 4-C1-C: H: H S-CH: C1 CF: 1  29 N NH: H S-CH: C1 CF: 1  30 N NHCH: H S-CH: C1 CF: 1  31 N N (CH:): H S-CH: C1 CF: 1  32 N N (C2H:): H S-CH: C1 CF: 1  33 N NHC: H: H S-CH: C1 CF: 1  34 N SCH: H 4-C1 C1 CF: 1  35 CC1 CH: H H C1 OCF: 1		N	C2Hs	H	H	Cl	CF:	_ [
5 N	3	N	CH (CH; ) 2	H	H	Cl	CF:	1
6 N cyclohexyl H H C! CF; 1 7 N CF; H H H C1 CF; 1 8 N CC1; H H C1 CF; 1 9 N CC1=CC1; H H C1 CF; 1 10 N C4 H5 H H Br CF; 1 11 N 4-C1-C4 H5 H H Br CF; 1 12 N NH; H H CF; CF; 1 13 N NHCH; CH; H F OCF; 1 14 N N (CH;); H H F CYClohexyl 1 15 N N (C2H5); H H I C (CH;); 1 16 N NHC6 H5 H H OCF; CF; 1 17 N SCH; H H CF; CF; 1 18 N CH; H S-C1 C1 CF; 1 19 N C2H; H 5-C1 C1 CF; 1 20 N CH (CH;); H 5-Br C1 CF; 1 21 N C (CH;); H 5-C1 C1 CF; 1 22 N CYClohexyl H 5-OCH; C1 CF; 1 23 N CYClohexyl H 5-OCH; C1 CF; 1 24 N CF; H 5-C1 C1 CF; 1 25 N CC1; H 5-C1 C1 CF; 1 26 N CC1=CC1; H 5-Br C1 CF; 1 27 N C4 H5 H 5-C1 C1 CF; 1 28 N 4-C1-C4 H5 H 5-C1 C1 CF; 1 29 N NH; H 6-Br C1 CF; 1 30 N NHCH; H 6-CH; C1 CF; 1 31 N N(CH;); H 6-NO; C1 CF; 1 32 N N(C2H5); H 6-NO; C1 CF; 1 33 N NHCH; H 6-CH; C1 CF; 1 34 N SCH; H 6-CH; C1 CF; 1 35 CC1 CH; H 6-NO; C1 CF; 1 36 N NHCH; H 6-CH; C1 CF; 1 37 N NHCH; H 6-CH; C1 CF; 1 38 N SCH; H 4-C1 C1 CF; 1	4	N	C (CH:):	H	H	Cl	CF:	1
7 N CF: H H C1 CF: 1 8 N CC1: H H C1 CF: 1 9 N CC1=CC1: H H C1 CF: 1 10 N C. Hs H H Br CF: 1 11 N 4-C1-C. Hs H H Br CF: 1 12 N NH: H H CF: CF: 1 13 N NHCH: CH: H F OCF: 1 14 N N(CH:): H H F Cyclohexyl 1 15 N N(C2Hs): H H I CF: CF: 1 16 N NHC. Hs H H OCF: CI I 17 N SCH: H H CF: CF: 1 18 N CH: H S-C1 CI CF: 1 19 N C2H: H S-CN CI CF: 1 19 N C2H: H S-CN CI CF: 1 20 N CH(CH:): H S-Br CI CF: 1 21 N C(CH:): H S-F CI CF: 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH: CI CF: 1 23 N Cyclohexyl H S-OCH: CI CF: 1 24 N CF: H S-CI CI CF: 1 25 N CC1: H S-CI CI CF: 1 26 N CC1=CC1: H S-Br C1 CF: 1 27 N C. Hs H S-CI CI CF: 1 28 N 4-C1-C. Hs H S-CI, G-CI CF: 1 29 N NH: H S-CI, G-CI CF: 1 30 N NHCH: H S-CI, G-CI CF: 1 31 N N(CH:): H S-Br C1 CF: 1 32 N NH: H S-CI, G-CI CF: 1 33 N NHCH: H S-CI, G-CI CF: 1 34 N CCH: H S-CI, G-CI CF: 1 35 N CCI: CF: I CF: I 36 CCI CCH: H S-Br C1 CF: I 37 N C. Hs H S-CI, G-CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N NHC. Hs H S-CI CI CF: I 38 N SCH: H H-CI CI CF: I 38 CCI CH: H H CI CI CF: I	5	N	cyclopropyl	CH:	H	Cl	CF:	1
8 N CC1		N	cyclohexyl	H	H	Cl	CF.	1
9 N CC1=CC1: H H C1 CF: 1 10 N C6 Hs H H Br CF: 1 11 N 4-C1-C6 Hs H H Br CF: 1 12 N NH: H H CF: CF: 1 13 N NHCH: CH: H F OCF: 1 14 N N (CH:): H H F CF: CF: 1 15 N N (C2Hs): H H I CF: CF: 1 16 N NHC6 Hs H H OCF: CI II 17 N SCH: H H CF: CF: I 18 N CH: H S-CI CI CF: I 19 N C2H: H S-CN CI CF: I 20 N CH (CH:): H S-Br CI CF: I 21 N C (CH:): H S-Br CI CF: I 22 N Cyclopropyl H S-OCH: CI CF: I 23 N Cyclopropyl H S-OCH: CI CF: I 24 N CF: H S-CI CI CF: I 25 N CC1: H S-CI CI CF: I 26 N CC1-CC1: H S-Br CI CF: I 27 N C4 Hs H S-CI CI CF: I 28 N CYCLOPROPYL H S-CI CF: I 29 N NH: H S-CI CI CF: I 29 N NH: H S-CI CI CF: I 20 N CH-CI: H S-CI CI CF: I 21 N C(CI: H S-CI CI CF: I 22 N CYCLOPROPYL H S-CI CI CF: I 23 N CYCLOPROPYL H S-CI CI CF: I 24 N CF: H S-CI CI CF: I 25 N CC1: H S-CI CI CF: I 26 N CC1-CCI: H S-Br CI CF: I 27 N C4 Hs H S-CI CI CF: I 28 N 4-CI-C4 Hs H S-CI CF: I 39 N NHCH: H S-CI CF: I 30 N NHCH: H S-CI CF: I 31 N N(CH:): H S-CI CI CF: I 32 N N(C2Hs): H S-CI CI CF: I 33 N NHCC Hs H S-CI CI CF: I 34 N SCH: H S-CI CI CF: I 35 CCI CH: H H CI CF: I 36 CCI C2Hs H H CI CF: I		N	CF:	H	H	Cl	CF <sub>3</sub>	1
10 N C 6 Hs H H Br CF; 1 11 N 4-C1-C6 Hs H H Br CH; 1 12 N NH; H H CF; CF; 1 13 N NHCH; CH; H F OCF; 1 14 N N (CH;); H H F CYClohexyl I 15 N N (C2Hs); H H I C CF; CF; 1 16 N NHC6 Hs H H OCF; CI I 17 N SCH; H H CF; CF; 1 18 N CH; H S-CI CI CF; 1 19 N C2Hs H S-CN CI CF; 1 19 N C2Hs H S-CN CI CF; 1 20 N CH (CH;); H S-Br CI CF; 1 21 N C (CH;); H S-Br CI CF; 1 22 N CYClopropyl H S-OCH; CI CF; 1 23 N CYClohexyl H S-NO; CI CF; 1 24 N CF; H S-CI CI CF; 1 25 N CCI; H S-CH CI CF; 1 26 N CCI=CCI; H S-Br CI CF; 1 27 N C4 Hs H S-CI, 6-CI CI CF; 1 28 N 4-CI-C6 H; H 6-Br CI CF; 1 30 N NHCH; H 6-CH CI CF; 1 31 N N (CH;); H 6-NO; CI CF; 1 32 N N (C2H;); H 6-NO; CI CF; 1 33 N NHC6 Hs H 6-CH CI CF; 1 34 N SCH; H 4-CI CI CF; 1 35 CCI CH; H H CI OCF; 1 36 CCI C2H; H H CI OCF; 1		N	CCls	H	H .	Cl	CF:	1
11 N 4-C1-C. H. H H CF: CF: 1 12 N NH: H H CF: CF: 1 13 N NHCH: CH: H F OCF: 1 14 N N (CH:): H H F Cyclohexyl 1 15 N N (C2H:): H H I C (CH:): 1 16 N NHC: H. H CF: CF: 1 17 N SCH: H H CF: CF: 1 18 N CH: H S-C1 C1 CF: 1 19 N C2H: H S-CN C1 CF: 1 19 N C2H: H S-Br C1 CF: 1 20 N CH (CH:): H S-Br C1 CF: 1 21 N C (CH:): H S-Br C1 CF: 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH: C1 CF: 1 23 N Cyclohexyl H S-OCH: C1 CF: 1 24 N CF: H S-C1 C1 CF: 1 25 N CC1: H S-C1 C1 CF: 1 26 N CC1-CC1: H S-Br C1 CF: 1 27 N C Hs H S-C1 C1 CF: 1 28 N 4-C1-C. H: H 6-F C1 CF: 1 30 N NHCH: H 6-Br C1 CF: 1 31 N N (CH:): H 6-CN OCH: CF: 1 32 N N (C2H:): H 6-CN OCH: CF: 1 33 N NHC: H: H 6-CN C1 CF: 1 34 N SCH: H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH: H C-C1 CF: 1	9	N	CC1=CC1:	H	H	Cl	CF:	1
12 N NH2 H H CF2 CF1 1 13 N NHCH2 CH2 H F OCF2 1 14 N N(CH2): H H F Cyclohexyl 1 15 N N(C2H3): H H I C(CH2). 1 16 N NHC4 H5 H H OCF2 CI 1 17 N SCH2 H H CF3 CF2 I 18 N CH3 H S-C1 CI CF3 I 19 N C2H3 H S-CN CI CF4 I 20 N CH(CH2): H S-BF CI CF4 I 21 N C(CH3): H S-F CI CF5 I 22 N Cyclopropyl H S-OCH2 CI CF4 I 23 N Cyclohexyl H S-NO2 CI CF4 I 24 N CF4 H S-C1 CI CF5 I 25 N CC1 H S-C1 CI CF5 I 26 N CC1-CC1 H S-BF CI CF5 I 27 N C4H5 H S-C1 CI CF4 I 28 N 4-C1-C4H3 H 6-F CH3 CF4 I 30 N NHCH4 H 6-CH3 CI CF4 I 31 N N(CH3): H 6-NO2 CI CF4 I 32 N N(C2H3): H 6-NO2 CI CF4 I 33 N NHC4H3 H 6-CN OCH3 CF4 I 34 N SCH3 H 4-CI CI CF4 I 35 CCI CH3 H H CI OCF4 I 36 CCI C2H3 H H CI CF5 I 37 N C4H5 H C7 CI CF5 I 38 N NHC4H3 H 6-CN OCH3 CF4 I 38 N NHC5H5 H 6-OCH3 CI CF5 I 38 N NHC6H5 H 6-OCH4 CI CF5 I 38 N NHC6H5 H 6-OCH5 CI CF5 I 38 CCI CH5 H H CI OCF5 I	10	N	Ce Hs	H	H	Br	CF:	1
13 N NHCH; CH; H F OCF; 1 14 N N(CH;): H H F Cyclohexyl 1 15 N N(C2H;): H H I C(CH;): 1 16 N NHC; H; H H OCF; Cl 1 17 N SCH; H H CF; CF; 1 18 N CH; H S-Cl Cl CF; 1 19 N C2H; H S-CN Cl CF; 1 20 N CH(CH;): H S-Br Cl CF; 1 21 N C(CH;): H S-F Cl CF; 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH; Cl CF; 1 23 N Cyclohexyl H S-NO; Cl CF; 1 24 N CF; H S-Cl Cl CF; 1 25 N CCl; H S-Ch Cl CF; 1 26 N CCl=CCl; H S-Br Cl CF; 1 27 N C; H; H S-CL Cl CF; 1 28 N 4-Cl-C; H S-CL Cl CF; 1 29 N NH; H 6-Br Cl CF; 1 30 N NHCH; H 6-CH Cl CF; 1 31 N N(CH;): H 6-CN OCH; CF; 1 32 N N(C2H;): H 6-NO; Cl CF; 1 33 N NHC; H; H 6-CN OCH; CF; 1 34 N SCH; H 4-Cl Cl CF; 1 35 CCl CH; H H Cl OCF; 1 36 CCl C2H; H H Cl OCF; 1	11	·N	4-C1-C6 Hs	H	H	Br	CH <sub>3</sub>	1
14 N N(CH <sub>1</sub> ): H H H I Cyclohexyl 1 15 N N(C2H <sub>5</sub> ): H H I C(CH <sub>2</sub> ): 1 16 N NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> H H CF <sub>2</sub> CF <sub>1</sub> 1 17 N SCH <sub>2</sub> H H CF <sub>3</sub> CF <sub>4</sub> 1 18 N CH <sub>3</sub> H S-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 19 N C2H <sub>5</sub> H S-CN C1 CF <sub>4</sub> 1 20 N CH(CH <sub>2</sub> ): H S-Br C1 CF <sub>4</sub> 1 21 N C(CH <sub>3</sub> ): H S-F C1 CF <sub>4</sub> 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 23 N Cyclohexyl H S-NO <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 24 N CF <sub>4</sub> H S-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 25 N CC1 <sub>2</sub> H S-CH <sub>3</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 26 N CC1=CC1: H S-CH <sub>3</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H S-C1 <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 28 N 4-C1-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-F CH <sub>5</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 29 N NH <sub>2</sub> H 6-CH <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 30 N NHCH <sub>5</sub> H 6-CN OCH <sub>5</sub> CF <sub>4</sub> 1 31 N N(CH <sub>5</sub> ): H 6-CN OCH <sub>5</sub> CF <sub>4</sub> 1 33 N NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> H 6-OCH <sub>5</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 34 N SCH <sub>5</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 35 CC1 CH <sub>5</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 36 CC1 C2H <sub>5</sub> H H C1 OCF <sub>5</sub> 1	12	N	NH <sub>2</sub>	H	H	CF:	CF <sub>1</sub>	1
15 N N(C2H <sub>5</sub> ): H H H I C(CH <sub>2</sub> ): 1 16 N NHC <sub>5</sub> H <sub>5</sub> H H CF <sub>5</sub> CF <sub>6</sub> 1 17 N SCH <sub>2</sub> H H CF <sub>5</sub> CF <sub>6</sub> 1 18 N CH <sub>3</sub> H S-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 19 N C2H <sub>3</sub> H S-CN C1 CF <sub>7</sub> 1 20 N CH(CH <sub>2</sub> ): H S-Br C1 CF <sub>7</sub> 1 21 N C(CH <sub>3</sub> ): H S-F C1 CF <sub>7</sub> 1 22 N Cyclopropyl H S-OCH <sub>2</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 23 N Cyclohexyl H S-NO: C1 CF <sub>7</sub> 1 24 N CF <sub>4</sub> H S-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 25 N CC1 <sub>2</sub> H S-CH <sub>3</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 26 N CC1=CC1: H S-Br C1 CF <sub>7</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H S-C1, 6-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 28 N 4-C1-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 30 N NHCH <sub>3</sub> H 6-CH <sub>4</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 31 N N(CH <sub>3</sub> ): H 6-CN OCH <sub>3</sub> CF <sub>7</sub> 1 32 N N(C2H <sub>3</sub> ): H 6-CN OCH <sub>3</sub> CF <sub>7</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-OCH <sub>4</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 34 N SCH <sub>1</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 35 CC1 CH <sub>1</sub> H H C1 OCF <sub>7</sub> 1	13	N	NHCH.	CH:	H	F	OCF.	1
16 N NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> H H H OCF <sub>4</sub> CI 1 17 N SCH <sub>3</sub> H H H CF <sub>4</sub> CF <sub>4</sub> 1 18 N CH <sub>4</sub> H 5-CI CI CF <sub>5</sub> 1 19 N C2H <sub>5</sub> H 5-CN CI CF <sub>6</sub> 1 20 N CH (CH <sub>4</sub> ): H 5-Br CI CF <sub>6</sub> 1 21 N C (CH <sub>4</sub> ): H 5-F CI CF <sub>7</sub> 1 22 N cyclopropyl H 5-OCH <sub>2</sub> CI CF <sub>7</sub> 1 23 N cyclohexyl H 5-NO: CI CF <sub>7</sub> 1 24 N CF <sub>4</sub> H 5-CI CI CF <sub>7</sub> 1 25 N CCI <sub>2</sub> H 5-CH <sub>3</sub> CI CF <sub>7</sub> 1 26 N CCI <sub>2</sub> -CCI: H 5-Br CI CF <sub>7</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 5-CI, 6-CI CI CF <sub>7</sub> 1 28 N 4-CI-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-CI CI CF <sub>7</sub> 1 29 N NH: H 6-Br CI CF <sub>7</sub> 1 30 N NHCH <sub>4</sub> H 6-CH <sub>4</sub> CI CF <sub>7</sub> 1 31 N N (CH <sub>5</sub> ): H 6-CN OCH <sub>4</sub> CF <sub>7</sub> 1 32 N N (C2H <sub>5</sub> ): H 6-NO: CI CF <sub>7</sub> 1 33 N NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub> H 6-CN OCH <sub>6</sub> CF <sub>7</sub> 1 34 N SCH <sub>1</sub> H 4-CI CI CF <sub>7</sub> 1 35 CCI CH <sub>1</sub> H H CI OCF <sub>7</sub> 1	14	N	N (CH <sub>2</sub> ) :	H	H	F	cyclohexyl	1
17 N SCH2 H H CF. CF. 1  18 N CH3 H 5-C1 C1 CF. 1  19 N C2H3 H 5-CN C1 CF. 1  20 N CH (CH2): H 5-Br C1 CF. 1  21 N C (CH3): H 5-F C1 CF. 1  22 N Cyclopropyl H 5-OCH2 C1 CF. 1  23 N Cyclohexyl H 5-NO: C1 CF. 1  24 N CF2 H 5-C1 C1 CF. 1  25 N CC12 H 5-CH C1 CF. 1  26 N CC1=CC1: H 5-Br C1 CF. 1  27 N C2 H3 H 5-C1, 6-C1 C1 CF. 1  28 N 4-C1-C2 H3 H 6-F CH2 CF. 1  30 N NHCH3 H 6-Br C1 CF. 1  31 N N (CH3): H 6-CN OCH3 CF. 1  32 N N (C2H3): H 6-NO: C1 CF. 1  33 N NHCC H3 H 6-OCH3 C1 CF. 1  34 N SCH3 H 4-C1 C1 CF. 1  35 CC1 CH3 H H C1 OCF. 1	15	N	N (C2Hs) 2	H	H	I	C (CH <sub>3</sub> ) :	1
18 N CH <sub>3</sub> H 5-Cl Cl CF <sub>5</sub> 1 19 N C2H <sub>3</sub> H 5-CN Cl CF <sub>6</sub> 1 20 N CH (CH <sub>2</sub> ): H 5-Br Cl CF <sub>6</sub> 1 21 N C (CH <sub>3</sub> ): H 5-F Cl CF <sub>6</sub> 1 22 N cyclopropyl H 5-OCH <sub>2</sub> Cl CF <sub>6</sub> 1 23 N cyclohexyl H 5-NO: Cl CF <sub>6</sub> 1 24 N CF <sub>6</sub> H 5-Cl Cl CF <sub>7</sub> 1 25 N CCl <sub>2</sub> H 5-CH <sub>3</sub> Cl CF <sub>7</sub> 1 26 N CCl <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub> H 5-CH <sub>3</sub> Cl CF <sub>7</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 5-Cl, 6-Cl Cl CF <sub>7</sub> 1 28 N 4-Cl-C <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-F CH <sub>5</sub> CF <sub>7</sub> 1 29 N NH <sub>2</sub> H 6-Br Cl CF <sub>7</sub> 1 30 N NHCH <sub>3</sub> H 6-CH <sub>4</sub> Cl CF <sub>7</sub> 1 31 N N (CH <sub>3</sub> ): H 6-NO: Cl CF <sub>7</sub> 1 32 N N (C2H <sub>3</sub> ): H 6-NO: Cl CF <sub>7</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>5</sub> H 6-OCH <sub>5</sub> Cl CF <sub>7</sub> 1 34 N SCH <sub>3</sub> H 4-Cl Cl CF <sub>7</sub> 1 35 CCl CH <sub>1</sub> H H Cl CF <sub>7</sub> 1	16	N	NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	H	H	OCF.	CI	1
19 N C2H <sub>5</sub> H 5-CN C1 CF <sub>5</sub> 1 20 N CH (CH <sub>2</sub> ): H 5-Br C1 CF <sub>6</sub> 1 21 N C (CH <sub>3</sub> ): H 5-F C1 CF <sub>7</sub> 1 22 N cyclopropyl H 5-OCH <sub>2</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 23 N cyclohexyl H 5-NO: C1 CF <sub>7</sub> 1 24 N CF <sub>7</sub> H 5-Cl C1 CF <sub>7</sub> 1 25 N CCl <sub>2</sub> H 5-Ch <sub>3</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 26 N CCl <sub>2</sub> CCl <sub>2</sub> H 5-Br C1 CF <sub>7</sub> 1 27 N C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> H 5-Cl <sub>3</sub> Cl CF <sub>7</sub> 1 28 N 4-Cl-C <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-F CH <sub>3</sub> CF <sub>7</sub> 1 29 N NH: H 6-Br C1 CF <sub>7</sub> 1 30 N NHCH <sub>3</sub> H 6-Ch <sub>4</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 31 N N (CH <sub>3</sub> ): H 6-Ch <sub>4</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 32 N N (C2H <sub>3</sub> ): H 6-NO: C1 CF <sub>7</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-OCH <sub>3</sub> C1 CF <sub>7</sub> 1 34 N SCH <sub>3</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>7</sub> 1 35 CC1 CH <sub>3</sub> H H C1 OCF <sub>7</sub> 1	17	N	SCH:	H	H	CF:	CF:	1
20 N CH (CH <sub>2</sub> ): H 5-Br Cl CF: 1 21 N C (CH <sub>2</sub> ): H 5-F Cl CF: 1 22 N Cyclopropy! H 5-OCH: Cl CF: 1 23 N Cyclohexy! H 5-NO: Cl CF: 1 24 N CF: H 5-Cl Cl CF: 1 25 N CCl: H 5-CH: Cl CF: 1 26 N CCl=CCl: H 5-Br Cl CF: 1 27 N C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> H 5-Cl, 6-Cl Cl CF: 1 28 N 4-Cl-C <sub>2</sub> H <sub>3</sub> H 6-F CH: CF: 1 29 N NH: H 6-Br Cl CF: 1 30 N NHCH: H 6-CH: Cl CF: 1 31 N N (CH <sub>2</sub> ): H 6-CN OCH: CF: 1 32 N N (C2H <sub>2</sub> ): H 6-NO: Cl CF: 1 33 N NHC <sub>2</sub> H <sub>3</sub> H 6-OCH: Cl CF: 1 34 N SCH: H 4-Cl Cl CF: 1 35 CCl CH: H H Cl OCF: 1	18	N	CH <sub>3</sub>	H	5-C1	CI	CF:	1
21 N C (CH <sub>3</sub> ) 1 H 5-F C1 CF <sub>3</sub> 1 22 N cyclopropyl H 5-OCH <sub>2</sub> C1 CF <sub>3</sub> 1 23 N cyclohexyl H 5-NO <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 24 N CF <sub>3</sub> H 5-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 25 N CC1 <sub>2</sub> H 5-CH <sub>3</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 26 N CC1 <sub>3</sub> -CC1 <sub>2</sub> H 5-Br C1 CF <sub>4</sub> 1 27 N C <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 5-C1, 6-C1 C1 CF <sub>4</sub> 2 28 N 4-C1-C <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-F CH <sub>3</sub> CF <sub>4</sub> 1 29 N NH <sub>2</sub> H 6-Br C1 CF <sub>4</sub> 1 30 N NHCH <sub>4</sub> H 6-CH <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 31 N N (CH <sub>3</sub> ) 2 H 6-CN OCH <sub>4</sub> CF <sub>4</sub> 1 32 N N (C2H <sub>3</sub> ) 2 H 6-NO <sub>2</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 33 N NHC <sub>4</sub> H <sub>3</sub> H 6-OCH <sub>4</sub> C1 CF <sub>4</sub> 1 34 N SCH <sub>3</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>4</sub> 1 35 CC1 CH <sub>4</sub> H H C1 OCF <sub>4</sub> 1	19	N	C2Hs	H	5-CN	Cl	CF:	1
22 N Cyclopropyl H 5-OCH: CI CF: 1 23 N Cyclohexyl H 5-NO: CI CF: 1 24 N CF: H 5-CI CI CF: 1 25 N CCI: H 5-CH: CI CF: 1 26 N CCI=CCI: H 5-Br CI CF: 1 27 N C. H: H 5-CI. 6-CI CI CF: 1 28 N 4-CI-C. H: H 6-F CH: CF: 1 29 N NH: H 6-Br CI CF: 1 30 N NHCH: H 6-CH: CI CF: 1 31 N N (CH:): H 6-CN OCH: CF: 1 32 N N (C2H:): H 6-OCH: CI CF: 1 33 N NHC. H: H 6-OCH: CI CF: 1 34 N SCH: H 4-CI CI CF: 1 35 CCI CH: H H CI OCF: 1	20	N	CH (CH: ):	H	5-Br	Cl	CF:	1
23 N Cyclohexyl H 5-NO: Cl CF: 1 24 N CF: H 5-Cl Cl CF: 1 25 N CCl: H 5-Ch Cl CF: 1 26 N CCl=CCl: H 5-Br Cl CF: 1 27 N C. H: H 5-Cl, 6-Cl Cl CF: 1 28 N 4-Cl-C. H: H 6-F Ch CF: 1 29 N NH: H 6-Br Cl CF: 1 30 N NHCH: H 6-Ch Cl CF: 1 31 N N (CH:): H 6-CN OCH CF: 1 32 N N (C2H:): H 6-NO: Cl CF: 1 33 N NHC. H: H 6-OCH Cl CF: 1 34 N SCH: H 4-Cl Cl CF: 1 35 CCl CH: H H Cl OCF: 1	21	N	C (CH <sub>2</sub> ) ,	H	5-F	Cl	CF:	I
24 N CF; H 5-Cl Cl CF; 1 25 N CCl; H 5-Ch; Cl CF; 1 26 N CCl=CCl; H 5-Br Cl CF; 1 27 N C. H; H 5-Cl, 6-Cl Cl CF; 2 28 N 4-Cl-C. H; H 6-F Ch; CF; 1 29 N NH; H 6-Br Cl CF; 1 30 N NHCH; H 6-Ch; Cl CF; 1 31 N N (CH;); H 6-CN OCH; CF; 1 32 N N (C2H;); H 6-NO; Cl CF; 1 33 N NHC. H; H 6-OCH; Cl CF; 1 34 N SCH; H 4-Cl Cl CF; 1 35 CCl CH; H H Cl OCF; 1	22	N	cyclopropy!	H	5-0CH:	CI	CF:	l
25 N CC1: H 5-CH; C1 CF: 1 26 N CC1=CC1: H 5-Br C1 CF: 1 27 N C4H; H 5-C1, 6-C1 C1 CF: 2 28 N 4-C1-C4H; H 6-F CH; CF: 1 29 N NH: H 6-Br C! CF: 1 30 N NHCH; H 6-CH; C1 CF: 1 31 N N (CH;): H 6-CN OCH; CF: 1 32 N N (C2H;): H 6-NO; C1 CF; 1 33 N NHC4H; H 6-OCH; C1 CF; 1 34 N SCH; H 4-C1 C1 CF; 1 35 CC1 CH; H H C1 OCF; 1	23	N	cyc lohexy l	H	5-NO:	Cl	CF:	l
26 N CC1=CC1: H 5-Br C1 CF: 1 27 N C4 H5 H 5-C1, 6-C1 C1 CF: 2 28 N 4-C1-C4 H5 H 6-F CH5 CF: 1 29 N NH: H 6-Br C1 CF: 1 30 N NHCH1 H 6-CH2 C1 CF: 1 31 N N (CH2): H 6-CN OCH3 CF: 1 32 N N (C2H5): H 6-NO: C1 CF: 1 33 N NHC4 H5 H 6-OCH5 C1 CF: 1 34 N SCH5 H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH5 H H C1 OCF5 1	24	N	CF.	H	5-C1	C1	CF:	1
26 N CC1=CC1: H 5-Br C1 CF: 1 27 N C4 Hs H 5-C1.6-C1 C1 CF: 2 28 N 4-C1-C4 Hs H 6-F CH: CF: 1 29 N NH: H 6-Br C1 CF: 1 30 N NHCH: H 6-CH: C1 CF: 1 31 N N (CH:): H 6-CN OCH: CF: 1 32 N N (C2H:): H 6-NO: C1 CF: 1 33 N NHC4 Hs H 6-OCH: C1 CF: 1 34 N SCH: H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH: H H C1 OCF: 1	25	N	CC1:	H	5-CH.	Cl	CF:	1
27 N C4 H3 H 5-C1, 6-C1 C1 CF2 2 28 N 4-C1-C4 H3 H 6-F CH3 CF2 1 29 N NH2 H 6-Br C1 CF3 1 30 N NHCH3 H 6-CH4 C1 CF3 1 31 N N (CH3) 2 H 6-CN OCH4 CF3 1 32 N N (C2H3) 2 H 6-NO2 C1 CF3 1 33 N NHC4 H3 H 6-OCH4 C1 CF4 1 34 N SCH4 H 4-C1 C1 CF5 1 35 CC1 CH4 H H C1 OCF5 1	26	N	CCI=CCI:	H		Cl		1.
28 N 4-C1-C4H3 H 6-F CH3 CF2 1 29 N NH2 H 6-Br C1 CF3 1 30 N NHCH3 H 6-CH3 C1 CF3 1 31 N N (CH3) 2 H 6-CN OCH3 CF2 1 32 N N (C2H3) 2 H 6-NO2 C1 CF3 1 33 N NHC4H3 H 6-OCH3 C1 CF3 1 34 N SCH3 H 4-C1 C1 CF3 1 35 CC1 CH3 H H C1 OCF3 1 36 CC1 C2H3 H H C1 CF5 1	27	N	C4 H5	H				2
29 N NH: H 6-Br C! CF: 1 30 N NHCH: H 6-CH: C1 CF: 1 31 N N (CH:): H 6-CN OCH: CF: 1 32 N N (C2H:): H 6-NO: C1 CF: 1 33 N NHC: H: H 6-OCH: C1 CF: 1 34 N SCH: H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH: H H C1 OCF: 1 36 CC1 C2H: H H C1 CF: 1	28	N	4-C1-C4 H3	H		CH:		
30 N NHCH; H 6-CH; C1 CF; 1 31 N N (CH;); · H 6-CN OCH; CF; 1 32 N N (C2H;); H 6-NO; C1 CF; 1 33 N NHC; H; H 6-OCH; C1 CF; 1 34 N SCH; H 4-C1 C1 CF; 1 35 CC1 CH; H H C1 OCF; 1 36 CC1 C2H; H H C1 CF; 1	2,9	N	NH:	Н .				
31 N N (CH;); · H 6-CN OCH; CF; 1 32 N N (C2H;); H 6-NO; C1 CF; 1 33 N NHC; H; H 6-OCH; C1 CF; 1 34 N SCH; H 4-C1 C1 CF; 1 35 CC1 CH; H H C1 OCF; 1 36 CC1 C2H; H H C1 CF; 1	30	N	NHCH.	H				1
32 N N (C2H <sub>2</sub> ): H 6-NO: C1 CF: 1 33 N NHC <sub>2</sub> H: H 6-OCH: C1 CF: 1 34 N SCH <sub>2</sub> H 4-C1 C1 CF: 1 35 CC1 CH: H H C1 OCF: 1 36 CC1 C2H <sub>2</sub> H H C1 CF: 1	31	N	N (CH <sub>1</sub> ) 2 .					
33 N NHC. H. H. 6-OCH. CI CF. I 34 N SCH. H. 4-CI CI CF. I 35 CCI CH. H. H. CI OCF. I 36 CCI C2H. H. H. CI CF. I	32							
34 N SCH <sub>2</sub> H 4-C1 C1 CF <sub>2</sub> I 35 CC1 CH <sub>2</sub> H H C1 OCF <sub>2</sub> I 36 CC1 C2H <sub>3</sub> H H C1 CF <sub>2</sub> I								-
35 CC 1 CH <sub>2</sub> H H C1 OCF <sub>2</sub> 1 36 CC 1 C2H <sub>3</sub> H H C1 CF <sub>2</sub> 1								•
36 CC1 C2H <sub>3</sub> H H C1 CF <sub>2</sub> 1								-
או לו לווערוון! או או לווערווים ווייטווים	37	CCI	CH (CH <sub>2</sub> ) :	H	H	CI	CF.	i

```
19
                                                                                                 20
                      .38
                           CC1 C (CH1) 1
                                                H
                                                      H
                                                                  CI
                                                                         CF<sub>3</sub>
                                                                                       1
                      39
                          CCI cyclopropyl
                                                     H
                                                                         CF:
                                                CH3
                                                                  CI
                                                                                       1
                      40
                           CCI
                                cyclobexyl
                                                      H
                                                                  CI
                                                                         CF:
                      41
                          CCI CF:
                                                H
                                                      H
                                                                  CI
                                                                         CF:
                      42
                          CCI CCI.
                                                H
                                                      H
                                                                  CI
                                                                         CF:
                          CCI
                      43
                                CC1=CC12
                                                H
                                                      H
                                                                  Br
                                                                         CF:
                                                                                       1
                          CC1 C. H.
                      44
                                                H
                                                                         CF.
                                                                  Вг
                          CCl
                      45
                                4-C1-C. Hs
                                                H
                                                     H
                                                                         CH:
                                                                  Вг
                      46
                          CC1 NH:
                                                H
                                                      H
                                                                         CF<sub>3</sub>
                                                                  Br
                      47
                          CCI NHCH.
                                                CK2
                                                     H
                                                                  F
                                                                         CI
                      48
                          CC1 N (CH<sub>3</sub>) 2
                                                H
                                                     H
                                                                  F
                                                                         cyclohexyl
                      49
                          CC1 N (C2H<sub>3</sub>) 2
                                                     H
                                                H
                                                                  Ī
                                                                         C (CH<sub>3</sub>) 1
                      50
                          CC 1 NHC. Hs
                                                     H
                                                                  OCF:
                                                H
                                                                         CI
                      51
                          CC1 SCH3
                                               H
                                                     H
                                                                  OCF:
                                                                         CF:
                      52
                          CC1 CHs
                                                                         CF:
                                                H
                                                     5-C1
                                                                  C1
                      53
                          CCI
                                C2Hs
                                               H
                                                     5-CN
                                                                  CI
                                                                         CF:
                      54
                          CCI CH (CH<sub>3</sub>) 2
                                                                         CF:
                                                     5-Br
                                                                . CI
                      55
                          CC1 C (CH2) 2
                                                     5-F
                                                                 CI
                                                                         CF:
                                               H
                                cyclopropyl
                      56
                          CCI
                                               H
                                                     5-0CH:
                                                                  Cl
                                                                         CF:
                      57
                          CCI cyclohexyl
                                                     5-NO2
                                                                         CF:
                                                                  CI
                     58
                          CCI CF:
                                                     5-C1
                                                                         CF:
                                               H
                                                                  CI
                     59
                          CCI CCI.
                                               H
                                                     5-CH:
                                                                         CF:
                                                                  CI
                     60
                          CCI SCH2
                                                     7-C1
                                                                         CF:
                                                                  Cl
                     61
                          CCI C. H.
                                               H
                                                     5-C1, 6-C1 C1
                                                                         CF:
                          CC1 4-C1-C4 H5
                                               H
                                                     6-F
                                                                  CH2
                                                                         CF:
                          CC1 NH2
                                               H
                                                     6-Br
                                                                  Cl
                                                                         CF:
                          CC 1 NHCH<sub>4</sub>
                                               H
                                                     6-CH:
                                                                        CF:
                     64
                                                                  Cl
                     65
                          CCI N (CH<sub>2</sub>) 2
                                               H
                                                     6-CN
                                                                 CI
                                                                        CF:
                     66 CC1 N (C2Ha) :
                                                     6-NO:
                                                                 CI
                                                                        CF:
                     67 CCI NHC. H:
                                               H
                                                     6-CO: CH:
                                                                 CI
                                                                        CF:
 【0042】一般式(2)の好ましい化合物としては表
                                                                 7
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 H
                                                                                              CF:
                                                                                                     CF<sub>3</sub>
2に示す化合物が挙げられる。
                                                                 8
                                                                           H
                                                                                 H
                                                                                              F
                                                                                                     cyclohexyl
 【0043】表2
                                                                . 9
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 H
                                                                                              I
                                                                                                     C (CH<sub>3</sub>) 1
 (化12)
                                                                 10
                                                                     N.
                                                                           H
                                                                                 H
                                                                                              CF:
                                                                                                     CI
                                                                 11
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                                     CF:
                                                                                 5-C1
                                                                                              CI
                                                                 12
                                                                           H
                                                                                 5-CN
                                                                                              CI
                                                                                                     CF.
                                                                 13
                                                                           H
                                                                                                     CF:
                                                                                 5-Br
                                                                                              CI
                                                                 14
                                                                    N
                                                                                                     CF:
                                                                           H
                                                                                 5-F
                                                                                              Cl
                                                                 15
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 5-0CH:
                                                                                                     CF:
                                                                                              CI
                                                            40
                                                                 16
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 5-NO:
                                                                                                     CF:
                                                                                              CI
 [0044]
                                                                 17
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 5-CH:
                                                                                              CI
                                                                                                     CF:
                                                                 18
                                                                     N
                                                                           H
                                                                                 5-C1, 6-C1 C1
                                                                                                     CF:
No X
          R:
               Rı
                            R4
                                   R:
                                                                 19
                                                  n
                                                                                 6-F
                                                                                              CHs
                                                                                                    CF:
                                                                                                                   i
                                                                 20
                                                                    N
                                                                                                    CF:
                                                                           H
                                                                                 6-Br
                                                                                              CI
1
    N
          H
               H
                                   CI
                                                  ì
                                                                 21
                            CI
                                                                    N
                                                                                 6-CH:
                                                                                              Cl
                                                                                                    CF,
2
    N
          H
               Н
                            CI
                                   CF:
                                                  1
                                                                 22
                                                                    N
                                                                           H
                                                                                 6-CN
                                                                                              OCH:
                                                                                                    CF:
    N
          CHs
               H
                            CI
                                   CF:
                                                                 23
                                                                    N
                                                                           H
                                                                                 6-NO:
                                                                                              Cl
                                                                                                    CF:
    N
          H
               H
                            Br
                                   CF:
                                                                 24
                                                                    N
                                                                           H
                                                                                 6-0CH:
                                                                                             CI
                                                                                                    CF:
5
    N
          H
               H
                                   CH:
                                                                 25
                                                                    CC1 H
                            Br
                                                                                 H
                                                                                             CI
                                                                                                    Cl
    N
          CH
               H
                                   OCF<sub>3</sub>
                                                                26
                                                                    CCI
                            F
                                                           50
                                                                                 H
                                                                                             CI
                                                                                                    CF:
                                                                                                                  1
```

4

6

(11)

特開2003-40866

27   CC   CH   H   Br   CF   I   I   I   N   N   C6H5   H   H   I			•						(12)					特開200	3 – 4 (	8 (	6 6
28   CC    H   H   Br   CF   I   I7   N   SCH3   H   H   I						21		•								•	
20	27	CCI	CH3	H		Cl	CF:	ł		16	N	NHC6H5	H	H	. 1		
30 CCI CH, H F Cyclobayl I 20 N CH(R3) 2 H 5-RN I 31 CCI H H H F Cyclobayl I 20 N CH(R3) 2 H 5-BF I 32 CCI H H 1 C(CH.) 1 22 N CYCLOpropyl H 5-DCH3 1 2 N CYCLOpropyl H 5-DCH3 1 5-BF I 33 CCI H H 0 CF, I 22 N CYCLOpropyl H 5-DCH3 1 5-BF I 35 CCI H 5-BF CI CF, I 24 N CYCLOpropyl H 5-DCH3 I 5-BF CI CF, I 24 N CF3 H 5-CH3 I 5-	28	CCI	H	H		Br	CF:	1		17	N	SCH3	H	H	1		
31 CCI H H H I C(CH1): 1 20 N CH(CH3): 2 H 5-Br 1 32 CCI H H H 1 C(CH3): 1 21 N C(CH3): 3 H 5-CR 1 3-CCH3 1 3-CCH3 H B OCF, CI 1 1 22 N C(CH3): 1 5-CCH3 1 3-CCH3 1 3-CCH3 5-CCH CI CF, 1 22 N C(F3 H 5-CCI 1 5-CCI	29	CCI	H	H		Br	CH:	1		18	N	CH3	H	5-C1	1		
32 CCI H H I CCIGH): 1 20 N CH(CM3) 2 H 5-Br 1 22 CCI H H 1 C(CH): 1 21 N C(CH3) 3 H 5-Fr 1 33 CCI H H 0 OFF, CI 1 22 N Cyclopropyl H 5-OCH3 1 5-CH3 1 3-OCH3 5 CCI H 5-CI CI CF, 1 22 N Cyclopropyl H 5-OCH3 1 5-CH3 1 3-OCH3 5 CCI H 5-CR CI CF, 1 24 N CYCLOPROPYL H 5-OCH3 1 5-CH3 1 3-CH3 5 CCI H 5-Br CI CF, 1 24 N CYCLOPROPYL H 5-CH3 1 3-CH3 5 CCI H 5-Br CI CF, 1 25 N CCI3 H 5-CH3 1 3-CH3 7 CCI H 5-FR CI CF, 1 25 N CCI3 H 5-CH3 1 3-CH3 7 CCI H 5-Br CI CF, 1 27 N C6H5 H 5-CH3 1 3-CH3 7 CCI H 5-CH3 CI CF, 1 27 N C6H5 H 5-CH3 1 3-CH3 7 CCI CF, 1 28 N 4-CI-C6H5 H 6-Br 1 4-CI CF, 1 29 N NE2 H 6-Br 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CH3 1 4-CI CH 6-Br CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CH 6-CN CI CF, 1 28 N CCI CH3 1 H 1 1 4-CI CH 6-CN CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 32 N N(CH5) 2 H 6-DR 1 4-CI CF, 1 37 CCI CH3 1 H 1 1 4-CI CH 6-CN CI CF, 1 37 CCI CH3 1 H 1 1 4-CI CH 6-CN CI CF, 1 37 CCI CH3 1 H 1 1 4-CI CH 6-CN CI CF, 1 37 CCI CH3 1 H 1 1 4-CI CF, 1 32 N CCI CYCLOPROPYL CH3 H 1 1 4-CI CH 1 1 1 4-CI CH 1 1 1 1 4-CI CH 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	30	CCI	CH:	Н		F	Cl	1		19	. И	C2H5	H	5-CN	1		
22 CC   H H	31	CCI					cyclohexyl	I		20	N		H	5-Br	1		
33 CCI H H OCF, CI I 22 M Cyclopropyl H 5-0CH3 I 34 CCI H 5-C1 CI CF, I 23 N Cyclobexyl H 5-NO2 I 35 CCI H 5-Rr CI CF, I 28 N CF3 H 5-C1 I 38 CCI H 5-Rr CI CF, I 26 N CCI-CC12 H 5-Rr CI CF, I 26 N CCI-CC12 H 5-Rr CI CF, I 26 N CCI-CC12 H 5-Rr I 37 CCI H 5-NO. CI CF, I 28 N 4-CI-GH5 H 6-F I 40 CCI H 5-NO. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-NO. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-F I 41 CCI H 5-C1. CI CF, I 29 N NH2 H 6-CN I 41 CCI H 6-C1. CI CF, I 32 N N (C2H5) 2 H 6-CN I 41 CCI H 6-C1. CI CF, I 32 N N (C2H5) 2 H 6-C0C3 I 41 CCI H 6-C1. CI CF, I 33 N N NHC6H5 H H I 1 41 CCI H 6-CN. CI CF, I 37 CCI CHCH3) 2 H H I 1 CI CF, I 37 CCI CHCH3) 2 H H I 1 CI CCI CI CF, I 37 CCI CHCH3) 2 H H I 1 CI CCI CI CI CF, I 37 CCI CHCH3) 2 H H I 1 CI CCI CI	32	CCI						1			N				1		
34 CC1 H 5-C1 C1 CF 1 23 N Cyclohexyl H 5-NO2 1 1 35 CC1 H 5-CN C1 CF 1 24 N CF3 H 5-C1 1 36 CC1 H 5-Br C1 CF 1 1 24 N CF3 H 5-C1 1 37 CC1 H 5-F C1 CF 1 1 25 N CC12 H 5-Br C1 CF 1 27 N C6H5 H 5-C1 C C 2 3 N CC1 C C C C C C C C C C C C C C C C C	33	CCI				OCF:		1			N				1		
35 CCI H 5-Rr C1 CF, 1 10 24 N CF3 H 5-C1 1 1 36 CCI H 5-Br C1 CF, 1 10 25 N CCI3 H 5-CI3 I 1 37 CCI H 5-F C1 CF, 1 10 25 N CCI3 H 5-CI3 I 1 38 CCI H 5-OCH, C1 CF, 1 28 N 4-CI-C6H5 H 6-F I 1 4 CCI H 5-OCH, C1 CF, 1 28 N 4-CI-C6H5 H 6-F I 1 4 CCI H 5-CH, C1 CF, 1 29 N NE2 H 6-Br I 1 4 CCI H 7-C1 C1 CF, 1 29 N NCE13 H 6-CN I 1 4 CCI H 7-C1 C1 CF, 1 30 N N CCH50 2 H 6-CN I 1 4 CCI H 7-C1 C1 CF, 1 30 N N CCH50 2 H 6-CN I 1 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 32 N N CCH50 2 H 6-CN I 1 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 32 N N CCH50 2 H 6-D02 I 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 32 N N CCH50 2 H 6-D02 I 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 33 N N CCH50 2 H 6-D02 I 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 33 N N CCH50 2 H 6-D02 I 4 CCI H 6-Br C1 CF, 1 33 N N CCH50 2 H 6-D02 I 4 CCI H 6-D0, C1 CF, 1 36 CCI CH3 H H I 1 4 CCI H 6-D0, C1 CF, 1 37 CCI C(CH3) 3 H H I 1 4 CCI H 6-D0, C1 CF, 1 38 CCI CYClopropyl CH3 H H I 1 C I CCI CH3 H H I 1 C I C I CF I I 38 CCI CYClopropyl CH3 H H I I C I C I CF I I 38 CCI CYClopropyl CH3 H H I I C I C I CH3 I H H I I C I C I C I C I C I C I C I C	34	CCI						1			N				1		
38 CC1 H 5-Br C1 CF: 1 10 25 N CC13 H 5-Br 1 37 CC1 H 5-F C1 CF: 1 26 N CC1-CC12 H 5-Br 1 38 CC1 H 5-OCH. C1 CF: 1 27 N C6H5 H 5-C1,6-C1 2 2 39 CC1 H 5-OCH. C1 CF: 1 28 N 4-C1-C6H5 H 6-F 1 40 CC1 H 5-OCH. C1 CF: 1 29 N ME2 H 6-Br 1 41 CC1 H 7-C1 C1 CF: 1 30 N NECH3 H 6-CH3 1 42 CC1 H 5-CH. C1 CF: 2 31 N N (CH3) 2 H 6-CH3 1 42 CC1 H 6-F CH. C7: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-CH3 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-DN C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-DN C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-ON C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-ON C1 CF: 1 33 N N (CH3) 2 H 6-OCH 1 44 CC1 H 6-ON C1 CF: 1 38 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 40 C1 C1 C1 CF: 1 38 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 40 C1 C1 C1 C1 CF: 1 38 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 C1 C1 C1 C1 CF: 1 38 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 C1	35							1			N				1		
37 CC! H 5-PF C! CF: 1 26 N CCI-CC12 H 5-BF 1 33 CCI H 5-NCH CI CF: 1 27 N C6HS H 5-PC 1 2 3 CCI H 5-NCH CI CF: 1 28 N 4-CI-C6HS H 6-PC 1 4 CI CF: 1 28 N 4-CI-C6HS H 6-PC 1 4 CI CF: 1 28 N 4-CI-C6HS H 6-PC 1 4 CI CF: 1 29 N ME2 H 6-BF 1 4 CCI H 5-CI, 6-CI CI CF: 1 30 N NEGRIS H 6-CR3 1 4 CCI H 5-CI, 6-CI CI CF: 2 31 N N (CR3) 2 H 6-CN 1 4 CCI H 5-CI, 6-CI CI CF: 1 32 N N (CR3) 2 H 6-CN 1 4 CCI H 6-BF CH CI CF: 1 32 N N (CR3) 2 H 6-CN 1 4 CCI H 6-BF CH CI CF: 1 32 N N (CR3) 2 H 6-CN 1 4 CCI H 6-BF CH CI CF: 1 34 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 34 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 34 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 36 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 36 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 36 CCI CH 6-NO. CI CF: 1 38 CCI CHCH3 3 H H I CH	36	CCI						1	10		N				1		
38 CC1 H 5-OCH. C1 CF: 1 27 N C6H5 H 5-C1.6-C1 2 39 CC1 H 5-OCH. C1 CF: 1 28 N NH2 H 6-Br 1 41 CC1 H 7-C1 C1 CF: 1 28 N NH2 H 6-Br 1 42 CC1 H 5-C1.6-C1 C1 CF: 1 30 N NHCH3 H 6-CH3 1 43 CC1 H 6-F CH. CF: 1 32 N NCH3) 2 H 6-CN 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 32 N NCH3) 2 H 6-CN 1 45 CC1 H 6-CH. C1 CF: 1 33 N NHCH3 H 6-CN3 1 46 CC1 H 6-CH. C1 CF: 1 33 N NHCH3 H H 1 47 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 48 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 49 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 38 CC1 CH3 H H 1 40 CC1 CH3 H H 1 41 CC1 CC1 C1		CCI						1			N				1		
39 CC1 H 5-NO: C1 CF: 1 28 N 4-C1-C6H5 H 6-F 1 40 CC1 H 5-CH: C1 CF: 1 29 N NH2 H 6-Br 1 41 CC1 H 5-CL: 6-C1 C1 CF: 1 30 N NHCH3 H 6-Br 1 42 CC1 H 5-CL: 6-C1 C1 CF: 2 31 N N(CH3)2 H 6-CN 1 43 CC1 H 6-F CH: CF: 1 32 N N(CH3)2 H 6-NO2 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N N(CH3)2 H 6-NO2 1 45 CC1 H 6-F CH: C1 CF: 1 33 N N(CH3)2 H 6-NO2 1 46 CC1 H 6-CN C1 CF: 1 33 CC1 CH3 H H 1 47 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 35 CC1 CH(CH3)2 H H 1 48 CC1 H 6-ON: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 49 CC1 H 6-OC: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 40 CC1 H 6-CO: C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 41 CC1 C1 C								1							2		
40 CC1 H 5-CH C1 CF: 1 29 N NH2 H 6-Br 1 41 CC1 H 7-C1 C1 CF: 1 30 N NHCH3 H 6-CH3 1 42 CC1 H 5-C1.6-C1 CF: 2 31 N N (CH3) 2 H 6-CN 1 43 CC1 H 6-F CH CF: 1 32 N N(CH5) 2 H 6-NO2 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N NHC6H5 H 6-NO2 1 45 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N NHC6H5 H 6-NO2 1 46 CC1 H 6-CH C1 CF: 1 33 N NHC6H5 H 1 47 CC1 H 6-NO. C1 CF: 1 20 35 CC1 CH3 H H 1 48 CC1 H 6-NO. C1 CF: 1 36 CC1 CH3) 2 H H 1 49 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 C(CH3) 3 H 1 40 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 C(CH3) 3 H 1 40 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 C(CH3) 3 H 1 41 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 C(CH3) 3 H 1 42 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 C(CH3) 3 H 1 43 CC1 C1								1							1		
41 CC1 H 7-C1 C1 CF: 1 30 N NHCH3 H 6-CH3 1 42 CC1 H 5-C1.6-C1 C1 CF: 2 31 N N(CB15) 2 H 6-CN 1 43 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 32 N N(CB15) 2 H 6-OCH3 1 44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 32 N N(CB15) 2 H 6-OCH3 1 45 CC1 H 6-CH C1 CF: 1 33 N NHCH5 H 6-OCH3 1 46 CC1 H 6-CH C1 CF: 1 34 CC1 CB3 H H 1 47 CC1 H 6-CN C1 CF: 1 36 CC1 CH3) 2 H H 1 48 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 36 CC1 CHCH3) 2 H H 1 48 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3) 3 H H 1 49 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 Cyclopropyl CH3 H 1 49 CC1 H 6-OCH C1 CF: 1 38 CC1 Cyclopropyl CH3 H 1 31 に対している 5 日本 5 日								1							1		
42 CC1 H 5-C1.6-C1 C1 CF: 2 31 N N (CH3) 2 H 6-CN 1 43 CC1 H 6-F CH. CF: 1 32 N N (CH5) 2 H 6-NO2 1 44 CC1 H 6-F CH. CF: 1 33 N N (CH5) 2 H 6-NO2 1 44 CC1 H 6-CH. C1 CF: 1 34 CC1 CH3 H H 1 1 46 CC1 H 6-CN. C1 CF: 1 34 CC1 CH3 H H 1 1 47 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 36 CC1 CH3 H H 1 1 48 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 36 CC1 CH3 J H H 1 1 1 48 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 37 CC1 CH3) 2 H H 1 1 49 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 37 CC1 C(H3) 3 H H 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	41							1			N				1		
43 CCI H 6-F CH CF I 32 N N (C2H5) 2 H 6-NO2 1 44 CCI H 6-Br CI CF I 33 N NHC6HS H 6-OCH3 I 45 CCI H 6-Br CI CF I 34 CCI CH5 H I 46 CCI H 6-CH CI CF I 20 35 CCI CH5 H H I 47 CCI H 6-NO; CI CF I 20 35 CCI CH5 H H I 48 CCI H 6-OCH CI CF I 36 CCI CH(CH3) 2 H H I 49 CCI H 6-OCH CI CF I 37 CCI C(CH3) 3 H H I 49 CCI N 6-CO; CH CI CF I 38 CCI CH(CH3) 2 H H I 40 CCI N 6-CO; CH CI CF I 38 CCI CH(CH3) 2 H H I 40 CCI N 6-CO; CH CI CF I 38 CCI CH(CH3) 2 H H I 40 CCI N 6-CO; CH CI CF I 38 CCI CH(CH3) 2 H H I 40 CCI CI								2							1		
44 CC1 H 6-Br C1 CF: 1 33 N NHC6HS H 6-OCH3 1 45 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 34 CC1 CH3 H H 1 46 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 20 35 CC1 C2HS H H 1 47 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 37 CC1 C(H3) 3 H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 48 CC1 H 6-OH. C1 CF: 1 38 CC1 C2HS H H 1 1 48 CC1 C1								1							1		
45 CC1 H 6-Ch C1 CF: 1 20 35 CC1 CH3 H H 1 1 46 CC1 H 6-CN C1 CF: 1 20 35 CC1 C2H5 H H 1 1 47 CC1 H 6-NO; C1 CF: 1 36 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 48 CC1 H 6-NO; C1 CF: 1 36 CC1 CH(CH3) 2 H H 1 1 49 CC1 H 6-CO: Ch. C1 CF: 1 38 CC1 CYClopropyl CH3 H 1 1 31 CC1 CYClopropyl CH3 H 1 1 32 CC1 CYClopropyl CH3 H 1 1 33 CC1 CYClopropyl CH3 H 1 1 33 CC1 CYClopropyl CH3 H 1 1 CC1 CC1 CT3 H H 1 1 CC1 CC1 CT4 H 1 1 CC1 CC1 CT4 H 1 1 CC1 CC1 CT5 H H 1 1 CC1 CT5 H H 1 1 CC1 CC1 CT5 H H 1 CC1 CC1 CT5 H H 1 1 CC1 CC1 CT5								1			N	_			1		
46 CC1 H 6-CN C1 CF 1 20 35 CC1 C2H5 H H 1 1 47 CC1 H 6-NO: C1 CF 1 36 CC1 CH(H3) 2 H H 1 1 48 CC1 H 6-OCH C1 CF 1 37 CC1 C(H3) 3 H H 1 49 CC1 H 6-OCH C1 CF 1 38 CC1 Cyclopropyl CH3 H 1 49 CC1 H 6-CO:CH C1 CF 1 38 CC1 Cyclopropyl CH3 H 1 53 に示す化合物が挙げられる。 40 CC1 CF3 H H 1 53 に示す化合物が挙げられる。 41 CC1 CC1 CC1 H 1 54 CC1 CC1 CC1 CC1 H H 1 55 CC1 CH6C12 H H 1 56 CC1 NHCH3 2 H H 1 57 CC1 CH3) 3 H F 1 58 CC1 CH6H5 H H 1 59 CC1 CH6H5 H H 1 50 CC1 CH6H5 H H 1 50 CC1 CH3 H H 1 50 CC1 CH6H5 H H 1 50 CC1 CH6H3 2 H F 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 2 H F 5-C1 1 50 CC1 CH3 3 H 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 2 H F 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 2 H F 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 2 H F 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 1 H 1 1 50 CC1 CH6H3 2 H 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 1 H 1 1 50 CC1 CH6H3 1 H 5-C1 1 50 CC1 CH6H3 1 H 5-C1 1 50 CC1 CH6H5 H H 1 1 50 CC1 CH6H5 H 5-CH3 1 50 CC1 CH6H5 H F 5-C1 1 51 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 51 CC1 CH3 H 5-CH3 1 52 CC1 CH6H5 H F 5-C1 1 53 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 54 CC1 CH3 3 H 5-C1 1 55 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 56 CC1 CYClopropyl H 5-OCH3 1 57 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 58 CC1 CC13 H 5-CH3 1 59 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 59 CC1 CCH3 H 5-CH3 1 59 N CYClopropyl CH3 H H 1 1 50 CC1 CCH3 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H H 1 1 50 CC1 CCH3 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H H 1 1 50 CC1 CCH3 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H H 1 1 50 CC1 CCH3 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H H 1 1 50 CC1 CCH5 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H 6-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H H 1 1 50 CC1 CH6H5 H 5-CH3 1 50 N CYCLOPROPYL H 1 1 50 CC1 CH6H5 H 5-CH3 1 50 CC1 CH6H5 H 5 H 5 CT1 CH6H5 H 5 CT1	45							1			CCI				1		
47 CC1 H 6-NO: C1 CF: 1 36 CC1 CH(CH3)2 H H 1 1 48 CC1 H 6-OCH. C1 CF: 1 37 CC1 C(CH3)3 H H 1 1 C1 CF: 1 38 CC1 H 6-OCH. C1 CF: 1 38 CC1 Cyclopropy! CH3 H I 1 38 CC1 Cyclopropy! CH3 H I 1 C1 O O 4 5 ] 一般式(3) の好ましい化合物としては表 39 CC1 Cyclohexy! H H 1 1 C1 CC13 H C213 H H 1 1 C1 CC13 C1 CC13 H C213 H H 1 C1 C1 CC13 C1 C13 H C213 C1 C1 C13 C1 C1 C1 C13 C1 C1 C1 C	46	CCI						1	20.						i		
48 CC1 H 6-OCH, C1 CF, 1 37 CC1 C(CH3)3 H H I 1 49 CC1 H 6-CO, CH, C1 CF, 1 38 CC1 cyclopropyl CH3 H I 1 (0 0 4 5 1) 一般式 (3) の好ましい化合物としては表 39 CC1 cyclopexyl H H I 1 (0 0 4 6 6 ) 表 3	47	CCI						1							1		
CCI H 6-CO: CH: CI CF: 1	48	CCI				Cl		ì							t		
39 CCI cyclohexyl H H I I Sに示す化合物が挙げられる。 40 CCI CF3 H H I I CCI CCI3 H H I I I CCI CCI3 H H I I I CCI CCI3 H H I I I I I CCI CCI3 H H I I I I I I I I I I I I I I I I I	49	CCI			. (	Cl		1.							1		
(化13)	[0	0 4	5]	般式(3	3) o.	)好ま	しい化合物と	しては表		39	CCI			H	1		
42   CC1   CC1   CC1   CC1   CC1   CC1     43   CC1   CC6H5   H   H   I     44   CC1   4-C1-C6H5   H   H   I     46   CC1   NICH3   CH3   H   H   I     47   CC1   N   CCH3   2   H   H   I     48   CC1   N   CCH3   2   H   H   I     48   CC1   N   CCH3   2   H   H   I     48   CC1   N   CCH3   2   H   H   I     49   CC1   N   CCH3   2   H   H   I     40   CC1   SCH3   H   S-C1   I     40   CC1   SCH3   H   S-C1   I     50   CC1   SCH5   H   I   I     50	3 13	示す	化合物	が挙げら	られる	ò.				40	CCI	CF3	H	H	1		
A3 CC  C6H5	[ 0	0 4	6】表	3						41	CC 1	CC13	H	H	1		
C	( ít	1 3	1			_				42	CC 1	CC1=CC12	H	H	1		
30   45   CC1   NH2   H   H   H   H   H   H   H   H   H						ملا				43	CCI	C6H5	H	H	1		
1				(Ba) = #	**					44	CCI	4-C1-C6H5	H	H	1		
C   O   4   7					<u></u> ;		(3)		30	45	CCI	NH2	H	H	1		
No X R1   R2 R3   n   49 CC1 NHC6H5   H   H   I							,,,			46	CCI	NHCH3	CH3	H	1		
No X R1 R2 R3 n 49 CC1 NHC6H5 H H 1  1 N CH3 H H 1 50 CC1 SCH3 H H 1  2 N C2H5 H H 1 55 CC1 C2H5 H 5-CN 1  3 N CH (CH3) 2 H H 1 53 CC1 CH(CH3) 2 H 5-Br 1  4 N C (CH3) 3 H H 1 54 CC1 C (CH3) 3 H 5-F 1  5 N cyclopropyl CH3 H 1 56 CC1 cyclopropyl H 5-OCH3 1  6 N cyclobexyl H H 1 56 CC1 cyclopexyl H 5-NO2 1  7 N CF3 H H 1 57 CC1 CF3 H 5-C1 1  8 N CC13 H H 1 58 CC1 CC13 H 5-C1 1  9 N CC1=CC12 H H 1 59 CC1 SCH3 H 7-C1 1  10 N C6H5 H H 1 60 CC1 C6H5 H 5-C1 6-C1 2  11 N 4-C1-C6H5 H H 1 61 CC1 4-C1-C6H5 H 6-F 1  12 N NH2 H H 1 62 CC1 NHCH3 H 6-Br 1  13 N NHCH3 CH3 H 1 66 CC1 NHCH3 H 6-CH3 1  14 N N(CH3) 2 H H 1 66 CC1 NHCH3 H 6-CH3 1	[0	0 4	7]										H	H	1		
50 CC1 SCH3 H H I  1 N CH3 H H I 51 CC1 CH3 H 5-C1 1  2 N C2H5 H H I 52 CC1 C2H5 H 5-CN I  3 N CH (CH3) 2 H H I 53 CC1 CH (CH3) 2 H 5-Br I  4 N C (CH3) 3 H H I 54 CC1 C (CH3) 3 H 5-F I  5 N Cyclopropyl CH3 H I 56 CC1 Cyclopropyl H 5-0CH3 I  6 N Cyclobexyl H H I 56 CC1 Cyclobexyl H 5-N02 I  7 N CF3 H H I 57 CC1 CF3 H 5-C1 I  8 N CC13 H H I 58 CC1 CC13 H 5-CH3 I  9 N CC1=CC12 H H I 59 CC1 SCH3 H 7-C1 I  10 N C6H5 H H I 60 CC1 C6H5 H 5-C1.6-C1 2  11 N 4-C1-C6H5 H H I 61 CC1 4-C1-C6H5 H 6-F I  12 N NH2 H H I 62 CC1 NH2 H 6-Br I  13 N NHCH3 CH3 H I 63 CC1 NHCH3 H 6-CH3 I  14 N N(CH3) 2 H H I 6-CN I								_					H	H	1		
1       N       CH3       H       H       I       51       CCI       CH3       H       5-CI       I         2       N       C2H5       H       H       I       52       CCI       C2H5       H       5-CN       I         3       N       CH (CH3) 2       H       H       I       53       CCI       CH (CH3) 2       H       5-Br       I         4       N       C (CH3) 3       H       H       F-F       I         5       N       C (CH3) 3       H       H       5-F       I         5       N       C (CH3) 3       H       H       5-F       I         6       N       C (CH3) 3       H       5-F       I         6       N       C (CH3) 3       H       5-OCH3       I         7       N       CF3       H       H       5-OCH3       I         8       N       CC13       H       H       1       58       CC1       CC13       H       5-CH3       I         9       N       CC13       H       H       I       59       CC1       SCH3       H       7-C1       I	No.	X	Ri		R2	R3	n							H	1		
2 N C2H5 H H I								_					H		l		
3 N CH (CH3) 2 H H H 1 53 CC1 CH (CH3) 2 H 5-Br 1 4 N C (CH3) 3 H H 1 1 54 CC1 C (CH3) 3 H 5-F 1 5 N Cyclopropyl CH3 H 1 40 55 CC1 Cyclopropyl H 5-OCH3 1 6 N Cyclobexyl H H 1 56 CC1 Cyclobexyl H 5-NO2 1 7 N CF3 H H 1 57 CC1 CF3 H 5-C1 1 8 N CC13 H H 1 58 CC1 CC13 H 5-CH3 1 9 N CC1=CC12 H H 1 59 CC1 SCH3 H 7-C1 1 10 N C6H5 H H 1 60 CC1 C6H5 H 5-C1.6-C1 2 11 N 4-C1-C6H5 H H 1 61 CC1 4-C1-C6H5 H 6-F 1 12 N NH2 H H 1 62 CC1 NH2 H 6-Br 1 13 N NHCH3 CH3 H 1 63 CC1 NHCH3 H 6-CH3 1 14 N N (CH3) 2 H H 1 6-CN 1							1								. i		
4       N       C (CH3) 3       H       H       1       54       CC1       C (CH3) 3       H       5-F       1         5       N       cyclopropyl       CH3       H       1       40       55       CC1       cyclopropyl       H       5-OCH3       1         6       N       cyclopexyl       H       H       1       56       CC1       cyclopexyl       H       5-NO2       1         7       N       CF3       H       H       1       57       CC1       CF3       H       5-C1       1         8       N       CC13       H       H       1       58       CC1       CC13       H       5-CH3       1         9       N       CC1-CC12       H       H       1       59       CC1       SCH3       H       7-C1       1         10       N       C6H5       H       H       1       60       CC1       C6H5       H       5-C1       6-C1       2         11       N       4-C1-C6H5       H       H       1       61       CC1       NHCH3       H       6-Br       1         12       N       NHCH3							1						•		l		
5         N         cyclopropyl         CH3         H         1         40         55         CC1         cyclopropyl         H         5-0CH3         1           6         N         cyclobexyl         H         H         I         56         CC1         cyclobexyl         H         5-NO2         I           7         N         CF3         H         H         I         57         CC1         CF3         H         5-C1         I           8         N         CC13         H         H         5-CH3         H         5-CH3         I           9         N         CC1-CC12         H         H         I         59         CC1         SCH3         H         7-C1         I           10         N         C6H5         H         H         I         60         CC1         C6H5         H         5-C1         6-C1         2           11         N         4-C1-C6H5         H         H         I         61         CC1         4-C1-C6H5         H         6-F         I           12         N         NH2         H         H         I         62         CC1         NHCH3         H							1								i		
6 N cyclobexyl H H I	_						1								1		
7       N       CF3       H       H       1       57       CC1       CF3       H       5-C1       1         8       N       CC13       H       H       1       58       CC1       CC13       H       5-CH3       1         9       N       CC1-CC12       H       H       1       59       CC1       SCH3       H       7-C1       1         10       N       C6H5       H       H       1       60       CC1       C6H5       H       5-C1       6-C1       2         11       N       4-C1-C6H5       H       H       1       61       CC1       4-C1-C6H5       H       6-F       1         12       N       NH2       H       H       1       62       CC1       NH2       H       6-Br       1         13       N       NHCH3       CH3       H       1       63       CC1       NHCH3       H       6-CN       1         14       N       N(CH3)       2       H       H       1       64       CC1       N(CH3)       2       H       6-CN       1							l		40						l		
8       N       CC13       H       H       1       58       CC1       CC13       H       5-CH3       1         9       N       CC1=CC12       H       H       1       59       CC1       SCH3       H       7-C1       1         10       N       C6H5       H       H       I       60       CC1       C6H5       H       5-C1       6-C1       2         11       N       4-C1-C6H5       H       H       I       61       CC1       4-C1-C6H5       H       6-F       I         12       N       NH2       H       H       I       62       CC1       NH2       H       6-Br       I         13       N       NHCH3       CH3       H       I       63       CC1       NHCH3       H       6-CH3       I         14       N       N (CH3)       2       H       H       1       64       CC1       N (CH3)       2       H       6-CN       I				iexy l			1								1		
9 N CC1=CC12 H H I 59 CC1 SCH3 H 7-C1 I 10 N C6H5 H H I 60 CC1 C6H5 H 5-C1.6-C1 2 11 N 4-C1-C6H5 H H I 61 CC1 4-C1-C6H5 H 6-F I 12 N NH2 H H I 62 CC1 NH2 H 6-Br I 13 N NHCH3 CH3 H I 63 CC1 NHCH3 H 6-CH3 I 14 N N (CH3) 2 H H I 6-CN I							1								l		
10 N C6H5 H H I 60 CCI C6H5 H 5-CI.6-CI 2 11 N 4-CI-C6H5 H H I 61 CCI 4-CI-C6H5 H 6-F I 12 N NH2 H H I 62 CCI NH2 H 6-Br I 13 N NHCH3 CH3 H I 63 CCI NHCH3 H 6-CH3 I 14 N N (CH3) 2 H H I 64 CCI N (CH3) 2 H 6-CN I							1								l		
11 N 4-C1-C6H5 H H I       61 CCI 4-C1-C6H5 H 6-F I         12 N NH2 H H I       62 CCI NH2 H 6-Br I         13 N NHCH3 CH3 H I       63 CCI NHCH3 H 6-CH3 I         14 N N (CH3) 2 H H I       64 CCI N (CH3) 2 H 6-CN I				112			1								1		
12 N NH2 H H 1 62 CC1 NH2 H 6-Br 1 13 N NHCH3 CH3 H 1 63 CC1 NHCH3 H 6-CH3 1 14 N N (CH3) 2 H H 1 64 CC1 N (CH3) 2 H 6-CN 1							l l								2		
13 N NHCH3 CH3 H 1 63 CC1 NHCH3 H 6-CH3 1 14 N N(CH3) 2 H H 1 64 CC1 N(CH3) 2 H 6-CN 1				OHS			l								1		
14 N N (CH3) 2 H H 1 64 CC I N (CH3) 2 H 6-CN I				•			1								1		
				9			]								1		
i notation to the second of th							l								1		
	10	14	n wan	11 6	π	U	Į.		อบ	00	UUI	N (CN3) 6	п	0-1106	ı		

. . .

66 CC 1 NH (C6H5) H 6-OCH3 1 67 CC 1 SCH3 H 6-CO2CH3 1

【0048】一般式(4)の好ましい化合物としては表4に示す化合物が挙げられる。

【0049】表4

【化14】

[0050]

_				
No.	_X 		- R₁	R:
ı	N	Cl	CI	Cl
2	N	Cl	Cl	CF:
3	N	Cl	Cl	CH.
4	N	Cl	Cl	OCF:
5	N	CI	F	C1
6	N	Cl	Cl	C (CH <sub>1</sub> );
7	N	Cl	F	C (CH <sub>1</sub> ):
8	N	Cl	Βr	CF:
9	N	Вг	Вг	CH <sub>2</sub>
10	N	Вг	F	CF.
11	N	OSO: CH:	r	cyclohexyl
12	N	OSO: CH:	I	C (CH*):
13	N .	OCOCH:	I	CF:
.14	N	·C1	OCF:	CF:
15	N	C1	OCH:	CF:
16	N	Cl	CH:	CF:
17	CCI	CI	Cl	Cl
18	CCI	CI	ÇI	CF:
19	CCI	C1	C1	CH <sub>3</sub>
20	CCI	Cl	Cl	OCF.
21	CCI	Cl	F	CF.
22	CCI	Cl	Cl	C (CH <sub>1</sub> ) 1
23	CCI	CI	F	C (CH:);
24	CCI	CI	Br .	CF:
25	CCI	Br	Br	CH:
26	CCI	Br	F	CF.
27	100	OSO: CH:	F	cyclohexyl
28	CCI	OSO: CH:	I	C (CH <sub>1</sub> ) 1
29	CCI	OCOCH:	I	CI
30	CCI	CI	OCF:	CF:
31	CCI	Cl	OCH1	CF:
32	133	C1	CH:	CF.
[ 0	0 5			の好ましい具体例としては、
CH: (	COE1.	C2 Hs COC 1		CCOCI. (CHL): CHCOCI. CF. C

【発明の実施の形態】以下、本発明を詳細に説明する。本発明の一般式(1)で表されるN置換インドール誘導10 体は、次に示すように合成ルート1や合成ルート2によって製造することができるが、これら製造法に限定されるものではない。

【0053】 [合成ルート1] 一般式 (3) および一般式 (4) で示される化合物から一般式 (1) で示される N置換インドール誘導体の製造;

【0054】一般式(1)

【化15】

20

30

40

[式中R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、Xおよびaは前記で定義した ものと同じものを示す]で表されるN置換インドール誘 導体は、一般式 (3)

[0055] [化16]

[式中R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>およびnは前記で定義したものと同じ ものを示す]で表される化合物と一般式(4)

【0056】 【化17】

[式中X、Z、R.およびR. は前記で定義したものと同じものを示す]で表される化合物を、溶媒中塩基の存在下縮合させることにより合成することができる。

【0057】本合成法の出発物質となる一般式 (3) および一般式 (4) で示される化合物は、従来公知の方法により合成することができる (J. Org. Chem., (1985), 89, 5451; Chem. - Ztg., (1986), 307; J. Heterocycl. Chem., (1988), 25, 469:

Synthesis and Chemistry of Agrochemicals IV, ACS Symp osium Series 584, (1995) pp 443)。一般式(4)で表される化合物の使用量は、 一般式(3)で表される化合物に対して、通常0.5~ 2 当量、好ましくは 0.8~1.2当量である。上記反 応に用いる溶媒としては反応に不活性なものであれば何 れでもよく、例えばヘキサンなどの脂肪族炭化水素、ト ルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロロメタ ン、クロロペンゼンなどのハロゲン化炭化水素、メタノ ールやエタノールなどの脂肪族低級アルコール、酢酸エ チルエステル、酢酸プチルエステルなどの脂肪族エステ ル、テトラヒドロフランなどのエーテル系炭化水素、N. N-ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセトニトリ ルなどのニトリル類、ジメチルスルフォキシドなどのス ルフォキシド類、水及びそれらの混合物が挙げられる。

【0058】塩基としては例えば、KOHやNaOHなどのア ルカリ金属水酸化物、K: CO: やNa: CO: などのアルカリ金 属炭酸塩、MeONaやEtONaやt-BuOKなどの脂肪族低級アル コールのアルカリ金属塩、NaHなどのアルカリ金属水素 化物、ピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基、Tr iton Bなどの4級アンモニウム塩等などであり、好まし くはアルカリ金属水酸化物、アルカリ金属炭酸塩、脂肪 族低級アルコールのアルカリ金属塩、有機塩基である。 特にピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基などの 場合は、大過剰に用いて溶媒として使用することもでき る。またその使用量は一般式(3)で表される化合物に 対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から5 当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度で あり、好ましくは0℃から80℃である。また、得られた 一般式(1)で表されるN置換インドール誘導体はその ままでも用いることができるが、再結晶、蒸留およびシ リカゲル等を用いたクロマトグラフィーなどの通常用い られる方法により精製することができる。

【0059】 [合成ルート2]

第1工程:一般式(3) および一般式(4) で示される 化合物から一般式(2) で示される化合物の製造;

【0060】一般式(2)

【化18】

[式中R:、R:、R:、R:、Xおよびnは前記で定義したものと同じものを示す] で表される化合物は、米国特許出願第5599774号や特開平6-92935号公報に記載の方法などにより、一般式(5)

[0061]

(化19)

【式中R:、R:およびoは前記で定義したものと同じものを示す】で表される化合物を一般式(4)

[0062]

【化20]

[式中X、Z、R.およびR.は前記で定義したものと同じものを示す]で表される化合物を、溶媒中塩基の存在下縮合させることにより合成することができる。

【0063】本合成法の出発物質となる一般式(4)および一般式(5)で示される化合物は、従来公知の方法に準じて合成することができる。

【0064】一般式(5)の好ましい化合物としては表 5に示す化合物が挙げられる。

[0065]表5

【化21】

[0066]

30	No	R <sub>2</sub>	R;	n
30	1	H	H	1
	2	CH:	H	1
	3	H	5-C1	1
	4	CH1	5-CN	1
	5	H	5-Br	1
	6	H	5-F	1
	7	CH:	5-OCH.	1
	8	H	5-NO:	ì
	9	H	5-CH:	1
40	10	H	5-C1,.6-C1	2
	11	H	6-C1	1
	12	CH:	6-F	1
	13	H	6-Br	1
	14	H	6-CH:	1
	15	H	6-CN	,l
	16	CH:	6-NO <sub>2</sub>	1
	17	H	6-0CH:	l
	18	H	4-C1	1
	19	H	7-C1	1
50	20	H	6-CO: CH:	l

【0067】一般式(4)で表される化合物の使用量 は、一般式(5)で表される化合物に対して、通常0. 5~2当鼠、好ましくは0.8~1.2当鼠である。上 記反応に用いる溶媒としては反応に不活性なものであれ ば何れでもよく、例えばヘキサンなどの脂肪族炭化水 素、トルエン、キシレンなどの芳香族炭化水素、ジクロ ロメタン、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素、 メタノールやエタノールなどの脂肪族低級アルコール、 酢酸エチルエステル、酢酸ブチルエステルなどの脂肪族 エステル、テトラヒドロフランなどのエーテル系炭化水 10 素、N. N-ジメチルホルムアミドなどのアミド類、アセト ニトリルなどのニトリル類、ジメチルスルフォキシドな どのスルフォキシド類、水及びそれらの混合物が挙げら

【0068】塩基としては例えば、KOHやNaOHなどのア ルカリ金属水酸化物、K: CO: やNa: CO: などのアルカリ金 属炭酸塩、MeONaやEtONaやt-BuOKなどの脂肪族低級アル コールのアルカリ金属塩、NaHなどのアルカリ金属水素 化物、ピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基、Tr iton Bなどの4級アンモニウム塩等などであり、好まし くはアルカリ金属水酸化物、アルカリ金属炭酸塩、脂肪 族低級アルコールのアルカリ金属塩、有機塩基である。 特にピリジンやトリエチルアミンなどの有機塩基などの 場合は、大過剰に用いて溶媒として使用することもでき る。またその使用量は一般式(5)で表される化合物に 対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から5 当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度で あり、好ましくは0℃から80℃である得られた一般式 (2)で表されるN置換インドール誘導体はそのままで も次の第2工程に供することができるが、再結晶、蒸留 30 およびシリカゲル等を用いたクロマトグラフィーなどの 通常用いられる方法により精製した後、供することもで きる。

【0069】第2工程:一般式(2)で示される化合物 から一般式(1)で示される化合物の製造;

【0070】一般式(1)

【化22】

[式中Ri、Ri、Ri、Ri、Xおよびnは前記で定義した ものと同じものを示す〕で表されるN置換インドール誘 導体は、一般式(2)

[0071]

【化23】

【式中Ri、Ri、Ri およびnは前記で定義したものと同じ ものを示す]で表される化合物を、一般式(6) Ri COCI (6)

[式中Ri は前記で定義したものと同じものを示す]、ま たは一般式 (7)

 $(R_1 CO)_2 O$  (7)

[式中R<sub>1</sub> は前記で定義したものと同じものを示す]で示 される化合物と触媒の存在下反応させることにより合成 することができる。

【0072】本合成法で用いられる一般式(6)または 一般式(7)で示される化合物は、従来公知の方法によ り合成することができる。一般式 (6) または一般式 (7) で表される化合物の使用量は、一般式(2)で表 される化合物に対して、通常0.8~3当量、好ましく は1~2当量である。上記反応に用いる溶媒としては反 応に不活性なものであれば何れでもよく、例えばジクロ ロメタン、クロロベンゼンなどのハロゲン化炭化水素、 ニトロメタン、ニトロトルエンなどのニトロ化合物、ニ 硫化炭素、およびそれらの混合物が挙げられる。触媒と しては、酸クロライドや酸無水物を使ったFriedel-Craf ts反応等のアシル化反応に用いられる触媒が挙げられ、 ルイス酸触媒、例えばAICIIなどのアルミニウム化合 物、TiClaなどのチタン化合物、SnClaなどのスズ化合 物、BF:などのホウ素化合物、ZnCl:などの亜鉛化合物 や、フッ化水素、硫酸、ポリリン酸などのプレンステッ ド酸触媒が挙げられる。またその使用量は一般式(6) で表される化合物または一般式(7)で表される化合物 に対して通常0.5から10当量であり、好ましくは0.8から 5当量である。反応温度は通常-20℃から溶媒還流温度で あり、好ましくは0℃から100℃であるまた、得られたー 般式(1)で表されるN置換インドール誘導体はそのま までも用いることができるが、精製法としては再結晶、 蒸留およびシリカゲル等を用いたクロマトグラフィーな 40 どの通常用いられる方法により精製することができる。 【0073】本発明の一般式(1)で表されるN置換イ ンドール誘導体(以下、本化合物と称する)を農用およ び衛生場面で使用する場合、使用目的に応じてそのまま かまたは効果を助長あるいは安定にするために農薬補助 剤を混用して、農薬製造分野において一般的に行われて いる方法により、粉剤、細粒剤、粒剤、水和剤、フロア ブル剤、乳剤、マイクロカプセル剤、油剤、エアソー ル、加熱燻蒸剤(蚊取り線香、電気蚊取りなど)、フォ ッキングなどの煙霧剤、非加熱燻蒸剤、霉餌などの任意 50 の製剤形態の組成物にして使用することができる。

【0074】これらの種種の製剤は実際の使用に際して は、直接そのまま使用するか、または水で所望の濃度に 希釈して使用することができる。ここに言う農薬補助剤 として担体(希釈剤)およびその他の補助剤、例えば展 着剤、乳化剤、湿展剤、分散剤、固着剤、崩壊剤等を挙 げることができる。液体担体としては、トルエン、キシ レンなどの芳香族炭化水素、ブタノール、オクタノー ル、グリコールなどのアルコール類、アセトンなどのケ トン類、ジメチルホルムアミドなどのアミド類、ジメチ ルスルホキシドなどのスルホキシド類、メチルナフタレ 10 ン、シクロヘキサノン、動植物油、脂肪酸、脂肪酸エス テルなど、または灯油、軽油などの石油分留物や水など が挙げられる。固体担体としては、クレー、カオリン、 タルク、珪藻土、シリカ、炭酸カルシウム、モンモリロ ナイト、ペントナイト、長石、石英、アルミナ、鋸屑な どが挙げられる。

【0075】また乳化剤、分散剤としては通常界面活性剤が使用され、例えば高級アルコール硫酸ナトリウム、オテアリルトリメチルアンモニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニルエーテル、ラウリルをどの陰イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、陽イオン系界面活性剤、両イオン系界面活性剤がある。また展着剤としてはポリオキシエチレンフェニルエーテル、ポリオキシエチレンラウリルエーテルなどが挙げられ、湿展剤としてはポリオキシートなどが挙げられ、固着剤としてカルポキシメチルカートなどが挙げられ、固着剤としてカルポキシメチルカロース、ポリピニルアルコールなどが挙げられ、崩壊剤としてはリグニンスルホン酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどが挙げられる。

【0076】さらにこれら本発明化合物は2種以上の配 合使用によって、より優れた殺虫活性を発現させること も可能であり、また他の生理活性物質、殺虫剤としては 例えばアレスリン、フタルスリン、パーメスリン、デカ メスリン、フェンパレレート、シクロプロトリンなどの ピレスロイド系化合物、DDVP、フェニトロチオン、ダイ アジノン、テメホスなどの有機リン系化合物、NAC、MTM C、BPMC、ピリマーなどのカーパメート系化合物、テブ フェノジド、クロマフェノジドなどのヒドラジン系化合 物、クロルフルアズロンなどのベンソイルウレア系化合 物、昆虫ホルモン剤、BT剤などが挙げられ、その他殺ダ 二剤、殺線虫剤、殺菌剤、除草剤、植物成長調節剤、肥 料、その他の農薬などと混合することのよりさらに効力 .の優れた多目的組成物をつくることもでき、また相乗効 果も期待することができる。さらに例えばピベルニルブ トキサイド、サルホキサイド、サフロキサンなどのピレ スロイド系殺虫剤用の共力剤として知られているものを 加えることにより、この効果を数倍増強させることも可 能となる。また、本発明化合物は光、熱、酸化等に安定 性が高いが、必要に応じて酸化防止剤あるいは紫外線吸 50 収剤、例えばBHT、BHAのようなフェノール類、 $\alpha$ -ナフチルアミンなどのアリールアミン類、あるいはベンゾフェノン系化合物を安定剤として適宜加えることによって、より効果の安定した組成物を得ることができる。本発明組成物中の有効成分含有量は剤系形態、施用方法、その他の条件により異なり、場合によっては有効成分化合物のみでもよいが、通常は $0.2\sim95\%$ (重量)、好ましくは $0.5\sim80\%$ (重量)の範囲である。

【0077】本発明の化合物の使用量は剤形、施用する 方法、時期、その他の条件によって変化するが、農園芸 用剤、森林害虫用剤および牧野害虫用剤は通常10アー ル当り有効成分量で10~300g、好ましくは15~200gが 使用され、衛生害虫用剤は通常1m2当り有効性分量で2~ 200mg、好ましくは5~100mgが使用される。たとえば粉 剤は10アール当り有効成分で15~120g、粒剤は有効成分 で30~240g、また乳剤、水和剤は有効成分で40~250gの 範囲である。しかしながら特別の場合には、これらの範 囲を超えることが、または下回ることが可能であり、ま た同時に必要でさえある。本化合物を殺寄生虫剤として 用いる場合、N置換インドール誘導体のみをそのまま用 いてもよいが、より効果的には、寄生虫を最も簡便化か つ効果的に防除するために、これら化合物群の滴下液 剤、液剤、噴霧剤、泡状製剤、錠剤、顆粒剤、細粒剤、 粉剤、カプセル剤、注射剤、座剤、チュアブル剤、シャ ンプー・リンス剤、首輪、飼料との混合剤など殺寄生虫 剤として許容される製剤を調製し、獣医学的に公知の方 法にて全身的または非全身的に適用動物に投与すること が好ましく、液化滴剤、噴霧剤が特に好適な製剤であ

30· 【0078】上記製剤中、例えば液化滴剤は、本化合物 0.1~20重量部およびグリコールまたはグリコールモノ アルキルエーテル10~95重量部含有する液状の経皮吸収 剤であり、必要により適宜他の成分を含有させることが できる。例えば、メタノール、エタノール、イソプロパ ノール、tert-ブタノール、ベンジルアルコール等のア ルコール類、炭酸プロピレン、N-メチル-2-ピロリド ン、水等の液状担体であり、グリコールまたはグリコー ルモノアルキルエーテルと容易に溶解するものである。 これらは本防除剤中に1~85重量部、好ましくは3~70重 量部含有し得る。本防除剤の動物への適用量は動物1頭 当たり、組成物として通常0.001~10mlであり、本化合 物量としては0.1~300mgである。また噴霧剤は、本化合 物0.1~20重量部、グリコール類、アルコール類および 界面活性剤を10~95重量部含有する液状の外部寄生虫駆 虫剤であるが、必要により適宜、他の成分を含有し得 る。例えば、グリコール類としては、ジエチレングリコ ール モノエチルエーテル、プロピレングリコール、グ リコールモノアルキルエーテルを例示することができ、 アルコール類としては、メタノール、エタノール、イソ プロパノール、tert-プタノール、ベンジルアルコール

32

などを例示することができる。界面活性剤としては、高 **. 級アルコール硫酸ナトリウム、ステアリルメチルアンモ** ニウムクロライド、ポリオキシエチレンアルキルフェニ ルエーテル、ラウリルペタインなどの陰イオン系界面活 性剤、陽イオン系界面活性剤、両性イオン系界面活性剤 があげられる。本防除剤の動物への施用量は適用する動 物あたり、組成物として通常0.01~100ml程度、本化合 物量として、0.1~300mg程度である。

【0079】その他の製剤についても、一般的に知られ ている界面活性剤、希釈剤、添加剤、安定剤など、組成 物の調整に必要とされる成分を加えてつくることができ

【0080】本発明の殺虫剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、 殺ダニ剤、共力剤、動物用飼料と混合または併用するこ ともできる。これらの例としては、例えばダイアジノン やDDVPなどの有機リン系化合物、カルポスルファンなど のカーパメート系化合物、シクロプロトリン、エトフェ ンプロクス、アレスリン、パーメスリンなどのピレスロ イド系化合物、イミダクロプリドなどのクロロニコチニ ル系化合物、フィプロニルなどのフェニルピラゾール系 20 化合物、ルフェヌロンなどのベンゾイルウレア系化合 物、メトプレン、ピリプロキシフェンなどの幼若ホルモ ン類似化合物、クロマフェノジド、テプフェノジドなど のヒドラジン系化合物、ミルベマイシン、イベルメクチ ン、モキシデクチン、セラメクチンなどのマクロライド 系化合物、その他ププロフェジン、アザディラクチンな どが挙げられる。上記製剤の投与方法については、各々 の製剤において行われている通常の方法にて実施するこ とができ、また動物に対する本化合物の投与量として は、0. lmg~300mg/kgであり、好ましくはlmg~200mgで あり、特に好ましくは10~100mgである。

【0081】本化合物の投与間隔は、その有効成分が動 物の体内に有効量残留し、目的とする効果を十分発揮で きる期間を設定する必要があり、このため各製剤によっ て異なる。例えば滴下液剤では投与間隔は1ヶ月から1年 であり、好ましくは1ヶ月から6ヶ月であり、特に好まし くは1ヶ月から3ヶ月である。

【0082】本発明の殺虫組成物の適用できる具体的な 審虫名を以下に挙げる。半翅目 (Hemiptera) として は、例えばツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticep 40 s)、セジロウンカ (Sogate furcifera)、トピイロウ ンカ (Nilaparvatalugens) 、ヒメトピウンカ (Laodelp bax striatellus)、ホソヘリカメムシ (Riptorutus clavatus)、ミナミアオカメムシ (Nezaraviridula)、 ナシグンバイ (Stephanitis pashi) 、オンシツコナジ ラミ (Trialeurodes vaporariorum) 、ワタアプラムシ (Aphis gossypii)、モモアカアプラムシ (Myzus ·perc ·icae)、ヤノネカカイガラムシ(Unasqis yanonensis i)、鱗翅目 (Lepidoptera) としてはキンモンホソガ (Phyllonorycter ringoneella) 、コナガ (Plutellax 50

ylostella) 、ワタミガ (Promalactis inonisema) 、 リンゴコカクモンハマキ (Adoxophyes orana)、マメ シンクイガ (Leguminivora glycinivorella) 、コブノ メイガ (Canaphalocrocis medinalis) 、ニカメイガ (Chilo supperessalis) 、アワノメイガ (Ostrinia 「urnacalis」、ヨトウガ (Mamestra brassicae)、ア ワヨトウ (Pseudaletia separata) 、ハスモンヨトウ (Spodopteralitura) 、イネツトムシ(Parnara gutta ta) 、モンシロチョウ (Pieris rapae crucivora) 、 ヘリオチス (Heliothis spp) 、鞘翅目 (Coleoptera) としては例えばドウガネブイブイ (Anomala cupre a)、マメコガネ (Popillia japonica)、イネゾウム シ(Echinocnemus sogameus)、イネミズゾウムシ(Li ssorhoptrus oryzophilus)、イネドロオイムシ (Oule ma oryzae)、ヒメマルカツオブシムシ(Anthrenus v erbasic)、コクヌスト(Tenebrioides mauritanicu s)、コクゾウムシ (Sitophilus zeamis)、ニジュウ ヤホシテントウ (Henosepilachna vigintioctopunctat a)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、 マツノマダラカミキリ (Monochamus alternatus)、ウ リハムシ (Aulacophora femoralis) 、レプチノタルサ ・デセムリネアタ (Leptinotarsa decemlineta)、フ ェドン・コクレアリアエ (Phaedon cochlearias)、ジ アプロチカ (Diabrotica spp.)、膜翅目 (Hymenopter a) としては例えばカブラハバチ (Athalia rosae jap onesis)、ルリチュウレンジハバチ (Argesimilis)、 双翅目 (Diptera) としては例えばネッタイイエカ (Cul ex pipiens fatigans)、ネッタイシマカ (Aedes ae gypti)、ダイズサヤタマパエ(Asphondylls spp.)、 タネバエ (Hylemyaplatura)、イエバエ (Musca domes tica viclna)、ウリミパエ (Dacus cucurcitae)、 イネハモグリバエ (Agromyzaoryzae) 、キンパエ (Luci lia spp.)、ノイエパエ (Musca harvei)、クロイエ パエ (MuscaBezzii) 、ノサシパエ (Haematobia irrit ans)、ツメトゲブユ (Simuliumiwatens)、ウシヌカカ (Culicoides oxystoma)、ウシアプ (Tabanuschr ys urus)、アカイエカ (Culex pipiens)、ヒトスジシマ カ (Aedes albopictus) 、総翅目 (Thysanoptera) と しては例えばチャノキイロアザミウマ(Scirtothrips dorsalls)、ネギアザミウマ (Thrips tabaci)、ミナ ミキイロアザミウマ (Thrips palmi) 、イネアザミウ マ (Baliothrips biformis) 、シラミ目 (Anoplura) としては例えばコロモジラミ (Pediculs humanus cor poris)、ケジラミ (Pthirus pubis)、ウジシラミ (H aematopinus eurysternus)、ヒツジシラミ (Damalini a ovis)、チャタテムシ目(Psocoptera)としては例 えばコチャタテ (Trogium pulsatorium) 、ヒラタチャ タテ(Liposcelis bostrychophilus)、直翅目として は例えばケラ (Gryllotalpa africana) 、トノサマバ ッタ (Locusta migratoria) 、コパネイナゴ (Oxya y

ezoensis)、チャパネゴキブリ (Blattella germanle a)、クロゴキブリ(Periplaneta fuliginosa)などが 挙げられ、隠翅目 (Aphaniptera) としては例えばヒトノ ミ (Pulex irritans)、ネコノミ (Ctenocephalides [eli s)、イヌノミ(Ctenocephalides canis)、ケオプスネズ ミノミ (Xenopsylla cheopis)、トゲノミの一種 (Ceratop hyllus spp.)などが挙げられ、ダニ目としては例えば フタトゲチマダニ(Haemaphysalis longicornis)、オ ウシマダニ(Boophilus microplus)、ミミヒゼンダニ\* \* の一種 (Otodectes spp.)、イエダニの一種 (Ornithonyss us spp.)、ツツガムシの一種(Trombicula spp.)、イヌ センコウヒゼンダニの一種 (Sarcoptes spp.)、ネコショ ウセンコウヒゼンダニの一種 (Notoedres spp.)、リィピ セファラスの一種(Rhipicephalus spp.)などが挙げられ る。

34

【0083】また、本発明の殺虫組成物が適用できる寄 生虫およびそれによる病気を次に要約するが、これらに 限定されるものではない。

病 名	寄生虫
	Schistosoma mansoni, S. Japonicum, S. Haematobium (住血吸虫)
Ancyclostomiasis	Necator americanus, Ancyclostoma duodenale (鉤虫、線虫)
ーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーーー	Ascaris lumbricoldes (回虫、線虫) Wuchereria bancrofti. Brugia malayi (線虫)
Onchoceriasisまたは River blinduess Loiasis	Onchocerrca volvulus (線虫) 、 Loa loa (眼糸状虫、線虫)

30

【0084】また、本発明化合物が適用される対象動物 としては、ヒト、牛や豚、羊、ニワトリなどの家畜や、 イヌやネコ、マウス、ラット、ハムスター、リス、ウサ ギ、フェレット、アヒル、ハト、小鳥類などの小動物な どが挙げられる。

[0085]

【実施例】以下に実施例を示し、本発明をさらに具体的 に説明する

【0086】参考合成例:1-(3-クロロ-5-トリ フルオロメチルピリジン-2-イル) インドール インドール (2. 0g) をジメチルホルムアミド (20ml) に溶解 し、氷冷、窒素気流下で60%水素化ナトリウム (690mg) を添加した後、ジメチルホルムアミドn (4ml) に溶解し た2、3-ジクロロー5-(トリフルオロメチル)ピリ ジン(3.7g)を氷冷下に滴下した。滴下終了後60℃まで加 40 熱し、同温にて2.5時間攪拌した。室温とした後、反応 溶液を水中に注ぎ、酢酸エチルエステルにて抽出した。 有機層を水にて洗浄した後、無水硫酸ナトリウムにて乾 燥し、減圧下濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロ マトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチルエステル=3 0/1) で精製し、目的とする1-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル) インドール (4.85g、収率95%)を得た。融点:52-53℃

【0087】実施例1:1-(3-クロロー5-トリフ ルオロメチルピリジン-2-イル)-3-トリフルオロ 50 セチルインドール (以下単にNo7と配す。) を所定機

アセチルインドールの合成 (表1における化合物No. 7)

1-(3-クロロー5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)インドール (1. 0g) をCH: Cl: (100ml) に溶解 し、室温にて無水トリフルオロ酢酸 (J. 06g) を滴下し た。4時間加熱還流した後、無水トリフルオロ酢酸(1.06 g) を室温にて迫加し、さらに4時間加熱還流した。室温 とした後、反応溶液に水 (20ml) を加え、有機層を分取し た。有機層をMgSO:で乾燥後、溶媒留去した。得られた 残留物をカラムクロマトグラフィーに付し、n-ヘキサン /AcOEt (20:1) 流分より1 - (3-クロロー5-トリフル オロメチルピリジンー2-イル)-3-トリフルオロア セチルインドール (1.15g、収率87%) を白色固体として得. た。(m. p. 64-66℃)

ジメチルスルホキサシド85重量部、キシレン85重量部、 ニューカルゲン900 (竹本油脂社製) 20重量部を混合溶 解した。この混合溶液90重量部に得られた1-(3-ク ロロー5-トリフルオロメチルピリジンー2-イル)-3-トリフルオロアセチルインドール10量部を混合し乳 剤とした。

【0088】生物試験例1:ネコノミ成虫に対する効果 (死虫率)

実施例1にて得られた1-(3-クロロー5-トリフル オロメチルピリジンー2-イル) -3-トリフルオロア

度になるようにアセトン溶液に溶解し、0.1mlを直径2.8cm、高さ12cmのガラスチューブの底に滴下し、風乾した。風乾後、ネコノミ成虫10匹をガラスチューブに入れナイロンメッシュで蓋をし、室温:26℃、湿度:80%条件下に静置した。1日後、2日後に、生死を判定し、死虫率を算出した。対照薬剤としてアレスリン[(RS)-3-Allyl-2-methyl-4-oxocyclopent-2-enyl(1RS)cis,trans-2,2-dimethyl-3-(2-methlprop-1-enyl)cyc 101opropanecarboxylate]を用い、同様に死虫率を算出した。その試験結果を表6に示す。[0089]

表6

供試化合物	濃度	1 日後	2日後	
	μg/tube	死亡	死亡	
No7	10	100	100	
	1	100	100	
	0.1	10	100	
Allethrin	10	100	100	
	1	0	0	
開恢	-	0	0	

【0090】生物試験例2:フタトゲチマダニに対する 効果

No7の乳剤をネオグラミン0.01%添加した水道水にて表に示した濃度に希釈した。その希釈液に市販の0.5 X15cmのパスツールピペットを30秒間浸漬し、綿に垂直に立てて風乾した。風乾したパスツールピペットの頭部に綿を詰め、綿を詰めた端より、吸引ポン\*

\* プにてマダニ孵化幼虫を10匹吸引し、先端をバテで封 じた。吸引後ピペットはNa: HPO: の飽和溶液を入れたデ シケータ内に静置し、23℃で保存した。観察は2日 後、4日後に実施した。その結果を表7に示す。 【0091】

表7

供試化合物	濃度	2日後	4日後
	μg/tube	死亡	死亡
No7	10	100	100
	1	100	100
Allethrin	10	100	100
	1	0	0
開坟	-	0	0

【0092】生物試験例3:マウスにおける急性毒性試験

No7をオリブ油に所定濃度になるように溶解し、ゾンデを用いてstd:ddy系雄マウスに直接胃内に10ml/k g投与した。投与薬量は30、100、300mg/k gとした。投与3時間後、1、7、 $14日後に、生死数を計測した。比較としてフィブロニル <math>[(\pm)-5-Amino-1-(2,6-dichloro-\alpha,\alpha,\alpha-trifluoro-p-tolyl)-4-trifluoromethylsulfinylpyrazole-3-carbonitrile]を用い、同様に生死数を計測した。その結果を表8に示す。 <math>[0093]$ 

表 &

供試化合物	投与量 累積死亡数(死亡数/				試数)
	(mg/kg)	3時間後	1日後	7日後	14日後
No7	30	0/5	0/5	0/5	0/5
	100	0/5	0/5	0/5	0/5
	300	0/5	0/5	0/5	0/5
フィプロニル	30	0/5 -	1/5	1/5	1/5
	100	1/5	5/5	5/5	5/5

[0094]

【発明の効果】本発明によれば、農業分野および環境衛生分野における有害生物を、低薬量で有効に防除するこ※40

※とができる。またこれらは、哺乳動物、天敵昆虫、環境 に対しても安全かつ負荷の少ない防除を可能にする。

### フロントページの統き

F ターム(参考) 4C063 AA01 BB02 CC12 DD06 EE03 4C204 BB02 CB03 DB16 DB24 DB26 EB03 FB14 4H011 AC01 AC02 AC04 BA01 BA05 BB09 BC01 BC07 DA16